



PCT

特許協力条約に基づいて公開された国際出願

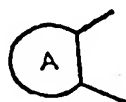
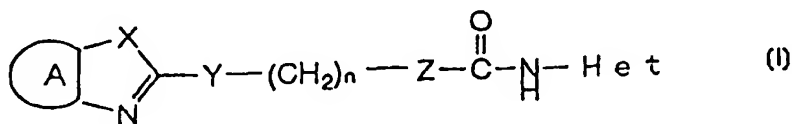
<p>(51) 国際特許分類 C07D 403/12, 413/12, 417/12, A61K 31/44, 31/505</p>	<p>A1</p>	<p>(11) 国際公開番号 WO99/25712</p> <p>(43) 国際公開日 1999年5月27日 (27.05.99)</p>		
<table border="1"> <tr> <td data-bbox="51 378 787 1079"> <p>(21) 国際出願番号 PCT/JP98/05149</p> <p>(22) 国際出願日 1998年11月16日 (16.11.98)</p> <p>(30) 優先権データ 特願平9/330877 1997年11月14日 (14.11.97) JP</p> <p>(71) 出願人 (米国を除くすべての指定国について) 興和株式会社(KOWA COMPANY, LTD.)(JP/JP) 〒460-8625 愛知県名古屋市中区錦三丁目6番29号 Aichi, (JP)</p> <p>(72) 発明者: および</p> <p>(75) 発明者/出願人 (米国についてののみ) 渋谷公幸(SHIBUYA, Kimiyuki)(JP/JP) 〒359-1142 埼玉県所沢市大字上新井729番地の1 ライオンズビルズ西所沢403号 Saitama, (JP) 三浦 徹(MIURA, Toru)(JP/JP) 〒331-0062 埼玉県大宮市土屋436-15 Saitama, (JP) 川峯勝巳(KAWAMINE, Katsumi)(JP/JP) 佐藤幸広(SATO, Yukihiro)(JP/JP) 〒189-0022 東京都東村山市野口町2-17-43 興和東村山寮 Tokyo, (JP) 扇谷忠明(OHGIYA, Tadaaki)(JP/JP) 〒359-0038 埼玉県所沢市北秋津96-1-106 Saitama, (JP) 北村崇博(KITAMURA, Takahiro)(JP/JP) 〒189-0022 東京都東村山市野口町2-17-43</p> </td> <td data-bbox="787 378 1500 1079"> <p>興和東村山荘202号 Tokyo, (JP) 尾崎千代香(OZAKI, Chiyoka)(JP/JP) 〒177-0045 東京都練馬区石神井台6-19-42 Tokyo, (JP) 枝野敏行(EDANO, Toshiyuki)(JP/JP) 〒350-1124 埼玉県川越市新宿町2-4-3 板谷川越パークハイツ304号 Saitama, (JP) 平田光輝(HIRATA, Mitsuteru)(JP/JP) 〒350-2211 埼玉県鶴ヶ島市脚折町2-27-19 Saitama, (JP)</p> <p>(74) 代理人 弁理士 佐伯憲生(SAEKI, Norio) 〒103-0027 東京都中央区日本橋三丁目15番2号 高愛ビル9階 Tokyo, (JP)</p> <p>(81) 指定国 AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CU, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, GB, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IS, JP, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZW, ARIPO特許 (GH, GM, KE, LS, MW, SD, SZ, UG, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), 欧州特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).</p> <p>添付公開書類 国際調査報告書</p> </td> </tr> </table>			<p>(21) 国際出願番号 PCT/JP98/05149</p> <p>(22) 国際出願日 1998年11月16日 (16.11.98)</p> <p>(30) 優先権データ 特願平9/330877 1997年11月14日 (14.11.97) JP</p> <p>(71) 出願人 (米国を除くすべての指定国について) 興和株式会社(KOWA COMPANY, LTD.)(JP/JP) 〒460-8625 愛知県名古屋市中区錦三丁目6番29号 Aichi, (JP)</p> <p>(72) 発明者: および</p> <p>(75) 発明者/出願人 (米国についてののみ) 渋谷公幸(SHIBUYA, Kimiyuki)(JP/JP) 〒359-1142 埼玉県所沢市大字上新井729番地の1 ライオンズビルズ西所沢403号 Saitama, (JP) 三浦 徹(MIURA, Toru)(JP/JP) 〒331-0062 埼玉県大宮市土屋436-15 Saitama, (JP) 川峯勝巳(KAWAMINE, Katsumi)(JP/JP) 佐藤幸広(SATO, Yukihiro)(JP/JP) 〒189-0022 東京都東村山市野口町2-17-43 興和東村山寮 Tokyo, (JP) 扇谷忠明(OHGIYA, Tadaaki)(JP/JP) 〒359-0038 埼玉県所沢市北秋津96-1-106 Saitama, (JP) 北村崇博(KITAMURA, Takahiro)(JP/JP) 〒189-0022 東京都東村山市野口町2-17-43</p>	<p>興和東村山荘202号 Tokyo, (JP) 尾崎千代香(OZAKI, Chiyoka)(JP/JP) 〒177-0045 東京都練馬区石神井台6-19-42 Tokyo, (JP) 枝野敏行(EDANO, Toshiyuki)(JP/JP) 〒350-1124 埼玉県川越市新宿町2-4-3 板谷川越パークハイツ304号 Saitama, (JP) 平田光輝(HIRATA, Mitsuteru)(JP/JP) 〒350-2211 埼玉県鶴ヶ島市脚折町2-27-19 Saitama, (JP)</p> <p>(74) 代理人 弁理士 佐伯憲生(SAEKI, Norio) 〒103-0027 東京都中央区日本橋三丁目15番2号 高愛ビル9階 Tokyo, (JP)</p> <p>(81) 指定国 AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CU, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, GB, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IS, JP, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZW, ARIPO特許 (GH, GM, KE, LS, MW, SD, SZ, UG, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), 欧州特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).</p> <p>添付公開書類 国際調査報告書</p>
<p>(21) 国際出願番号 PCT/JP98/05149</p> <p>(22) 国際出願日 1998年11月16日 (16.11.98)</p> <p>(30) 優先権データ 特願平9/330877 1997年11月14日 (14.11.97) JP</p> <p>(71) 出願人 (米国を除くすべての指定国について) 興和株式会社(KOWA COMPANY, LTD.)(JP/JP) 〒460-8625 愛知県名古屋市中区錦三丁目6番29号 Aichi, (JP)</p> <p>(72) 発明者: および</p> <p>(75) 発明者/出願人 (米国についてののみ) 渋谷公幸(SHIBUYA, Kimiyuki)(JP/JP) 〒359-1142 埼玉県所沢市大字上新井729番地の1 ライオンズビルズ西所沢403号 Saitama, (JP) 三浦 徹(MIURA, Toru)(JP/JP) 〒331-0062 埼玉県大宮市土屋436-15 Saitama, (JP) 川峯勝巳(KAWAMINE, Katsumi)(JP/JP) 佐藤幸広(SATO, Yukihiro)(JP/JP) 〒189-0022 東京都東村山市野口町2-17-43 興和東村山寮 Tokyo, (JP) 扇谷忠明(OHGIYA, Tadaaki)(JP/JP) 〒359-0038 埼玉県所沢市北秋津96-1-106 Saitama, (JP) 北村崇博(KITAMURA, Takahiro)(JP/JP) 〒189-0022 東京都東村山市野口町2-17-43</p>	<p>興和東村山荘202号 Tokyo, (JP) 尾崎千代香(OZAKI, Chiyoka)(JP/JP) 〒177-0045 東京都練馬区石神井台6-19-42 Tokyo, (JP) 枝野敏行(EDANO, Toshiyuki)(JP/JP) 〒350-1124 埼玉県川越市新宿町2-4-3 板谷川越パークハイツ304号 Saitama, (JP) 平田光輝(HIRATA, Mitsuteru)(JP/JP) 〒350-2211 埼玉県鶴ヶ島市脚折町2-27-19 Saitama, (JP)</p> <p>(74) 代理人 弁理士 佐伯憲生(SAEKI, Norio) 〒103-0027 東京都中央区日本橋三丁目15番2号 高愛ビル9階 Tokyo, (JP)</p> <p>(81) 指定国 AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CU, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, GB, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IS, JP, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZW, ARIPO特許 (GH, GM, KE, LS, MW, SD, SZ, UG, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), 欧州特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).</p> <p>添付公開書類 国際調査報告書</p>			

(54)Title: NOVEL AMIDE COMPOUNDS AND DRUGS CONTAINING THE SAME

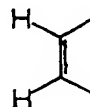
(54)発明の名称 新規アミド化合物及びこれを含有する医薬

(57) Abstract

Novel compounds having an ACAT inhibitory effect. Specifically, compounds represented by general formula (I) or salts or solvates thereof and medicinal compositions containing at least one of these compounds, wherein (A) represents a divalent residue of optionally substituted benzene, pyridine, cyclohexane or naphthalene, or (B); HET represents an optionally substituted, monocyclic, polycyclic or fused 5- to 8-membered heterocycle; X represents -NH-, oxygen or sulfur; Y represents -NR₄-, oxygen, sulfur, sulfoxide or sulfone; Z represents a single bond or -NR₅- (R₄ and R₅ representing each a specific group); and n is an integer of 1 to 15.



(A)

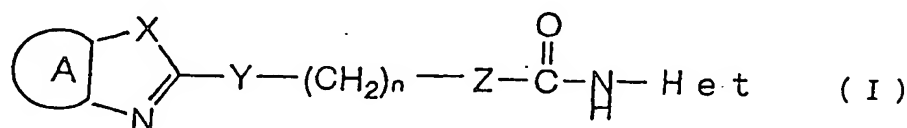


(B)

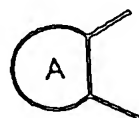
(57)要約

本発明は、新規な A C A T 阻害活性を有する化合物を提供する。

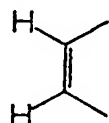
本発明は、一般式 (I)



(式中、



は、置換基を有してもよいベンゼン、ピリジン、シクロヘキサン、又はナフタレンの 2 価残基、又は基



を示し、

H E T は、5 ~ 8 員の置換又は非置換の単環式、多環式又は縮合環式の複素環を、X は - N H -、酸素原子又は硫黄原子を、Y は - N R 4 -、酸素原子、硫黄原子スルホキシド、又はスルホンを、Z は単結合又は - N R 5 - を、R 4、R 5 は特定の基をそれぞれ示し、n は 1 乃至 15 の整数を示す。)

で表される化合物、これらの塩又はこれらの溶媒和物、及びこれらの化合物の少なくとも 1 種を含有してなる医薬組成物に関する。

PCTに基づいて公開される国際出願のパンフレット第一頁に掲載されたPCT加盟国を同定するために使用されるコード(参考情報)

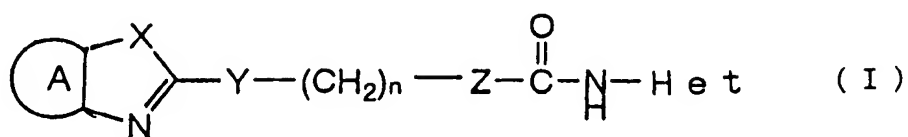
AE	アラブ首長国連邦	ES	スペイン	LI	リヒテンシュタイン	SG	シンガポール
AL	アルバニア	FI	フィンランド	LK	スリ・ランカ	SI	スロヴェニア
AM	アルメニア	FR	フランス	LR	リベリア	SK	スロヴァキア
AT	オーストリア	GA	ガボン	LS	レソト	SL	シエラ・レオネ
AU	オーストラリア	GB	英国	LT	リトアニア	SN	セネガル
AZ	アゼルバイジャン	GD	グレナダ	LU	ルクセンブルグ	SZ	スワジランド
BA	ボスニア・ヘルツェゴビナ	GE	グルジア	LV	ラトヴィア	TD	チャード
BB	バルバドス	GH	ガーナ	MC	モナコ	TG	トーゴ
BE	ベルギー	GM	ガンビア	MD	モルドヴァ	TJ	タジキスタン
BF	ブルキナ・ファソ	GN	ギニア	MG	マダガスカル	TM	トルクメニスタン
BG	ブルガリア	GW	ギニア・ビサウ	MK	マケドニア旧ユーゴスラヴィア共和国	TR	トルコ
BJ	ベナン	HR	クロアチア	ML	マリ	TT	トリニダード・トバゴ
BR	ブラジル	HU	ハンガリー	MN	モンゴル	UA	ウクライナ
BY	ベラルーシ	ID	インドネシア	MR	モーリタニア	UG	ウガンダ
CA	カナダ	IE	アイルランド	MW	マラウイ	US	米国
CF	中央アフリカ	IL	イスラエル	MX	メキシコ	UZ	ウズベキスタン
CG	コンゴ	IN	インド	NE	ニジェール	VN	ヴェトナム
CH	スイス	IS	アイスランド	NL	オランダ	YU	ユーゴスラビア
CI	コートジボアール	IT	イタリア	NO	ノルウェー	ZA	南アフリカ共和国
CM	カメルーン	JP	日本	NZ	ニュージーランド	ZW	ジンバブエ
CN	中国	KE	ケニア	PL	ポーランド		
CU	キューバ	KG	キルギスタン	PT	ポルトガル		
CY	キプロス	KP	北朝鮮	RO	ルーマニア		
CZ	チェッコ	KR	韓国	RU	ロシア		
DE	ドイツ	KZ	カザフスタン	SD	スーダン		
DK	デンマーク	LC	セントルシア	SE	スウェーデン		
EE	エストニア						

明 細 書

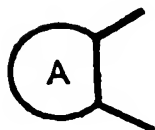
新規アミド化合物及びこれを含有する医薬

技術分野

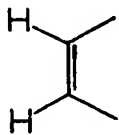
本発明は、新規アミド化合物及びこれを含有する医薬に関する。詳細には、一般式 (I)



(式中、



は、置換基を有していてもよいベンゼン、ピリジン、シクロヘキサン、又は、ナフタレンの2価残基、又は、基



を示し、

Hetは、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群から選ばれる少なくとも1個の異種原子を含有する5～8員の置換又は非置換の単環式、多環式又は縮合環式の複素環を示し、

Xは、-NH-、酸素原子又は硫黄原子を示し、

Yは、-NR₄-、酸素原子、硫黄原子、スルホキシド又はスルホンを示し、

Z は、単結合又は $-NR_s-$ を示し、

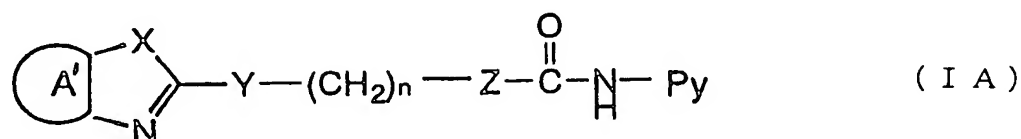
R_4 は、水素原子、低級アルキル基、アリール基又は置換基を有していてもよいシリル低級アルキル基を示し、

R_s は、水素原子、低級アルキル基、アリール基又は置換基を有していてもよいシリル低級アルキル基を示し、

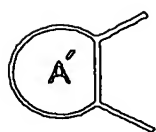
n は、1 乃至 15 の整数を示す。）

で表される化合物、これらの塩又はこれらの溶媒和物及びこれらの化合物からなる医薬組成物に関する。

より詳細には、本発明は、下記の一般式 (I A)、



(式中、



は、置換基を有していてもよいベンゼン又はピリジンの2価残基を示し、

Py は、置換基を有していてもよいピリジル基又はピリミジル基を示し、

X は、 $-NH-$ 、酸素原子又は硫黄原子を示し、

Y は、 $-NR_4-$ 、酸素原子、硫黄原子、スルホキッド又はスルホンを示し、

Z は、単結合又は $-NR_s-$ を示し、

R_4 は、水素原子、低級アルキル基、アリール基又は置換基を有していてもよいシリル低級アルキル基を示し、

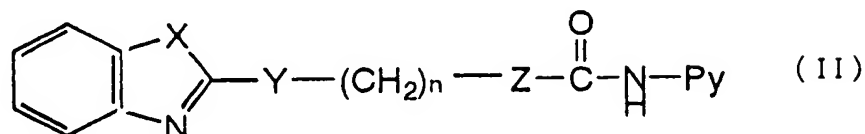
R_s は、水素原子、低級アルキル基、アリール基又は置換基を有していてもよい

シリル低級アルキル基を示し、

n は、1 乃至 15 の整数を示す。)

で表される化合物、これらの塩又はこれらの溶媒和物及びこれらの化合物からなる医薬組成物に関する。

さらに詳細には、本発明は、下記の一般式 (II)



(式中、X は -NH-、酸素原子又は硫黄原子を示し、

Y は、-NR₄-, 酸素原子、硫黄原子、スルホキシド又はスルホンを示し、

Z は単結合又は -NR_s- を示し、

R₄ は、水素原子、低級アルキル基、アリール基又は置換基を有していてもよいシリル低級アルキル基を示し、

R_s は、水素原子、低級アルキル基、アリール基又は置換基を有していてもよいシリル低級アルキル基を示し、

Py は、置換基を有していてもよいピリジル基又はピリミジル基を示し、

n は、1 乃至 15 の整数を示す。)

で表される化合物、これらの塩又はこれらの溶媒和物及びこれらの化合物からなる医薬組成物に関する。

背景技術

近年、生活水準の向上に基づく高カロリー、高コレステロールを含む欧米型食生活への変化ならびに人口の高齢化に伴い、高脂血症およびこれに起因する動脈硬化性疾患が急増してきており、これが一つの社会問題を呈している。これまでの高脂血症および動脈硬化症の薬物療法は主として原因となる血中の脂質を低下させることに重点が置かれており、動脈硬化病巣そのものを標的として治療するものではなかった。アシル コエンザイム A コレステロール アシルトランス

フェラーゼ (A C A T) はコレステロールからコレステロールエステルへの合成を触媒する酵素であり、コレステロールの代謝と消化管での吸収に重要な役割を果たすものである。小腸上皮細胞において遊離コレステロールのエステル化を行う A C A T 酵素を阻害することは腸管からのコレステロールの吸収を阻害し、また、肝臓においては A C A T 阻害に基づくコレステロールエステルの生成阻害が肝臓から血中への V L D L の分泌を抑制し、これらの結果により血中コレステロールの低下作用へとつながると考えられる。これまでの A C A T 阻害剤の多くはこれら小腸、肝臓の A C A T 酵素に作用させ、抗高脂血症剤として血中コレステロールの低下作用を期待するものであった。

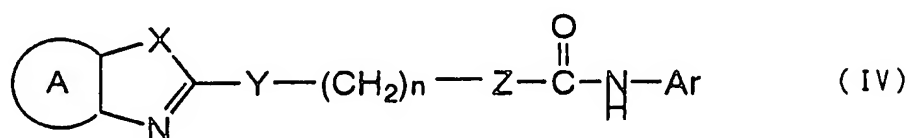
例えば、米国特許第 4, 716, 175 号明細書には 2, 2-ジメチル-N-(2, 4, 6-トリメトキシフェニル)ドデカンアミドが、また、ヨーロッパ特許第 372, 445 号公報には N'-(2, 4-ジフルオロフェニル)-N-[5-(4, 5-ジフェニル-1H-イミダゾール-2-イルチオ)ペンチル]-N-ヘブチルウレアなどが A C A T 阻害剤として記載されている。しかしながら、これまでの多くの A C A T 阻害剤は抗高脂血症剤として血中コレステロールの低下作用に重点を置き、その作用発現のための大量投与から臨床試験の段階で腸管出血、腸管障害、下痢や肝障害などの副作用が多発し、臨床開発を困難にしている。

そもそも動脈硬化症は血管の内膜肥厚と脂質蓄積という特徴的な病変であるが、最近の研究によると動脈硬化病巣の形成に中心的な役割を果たしているマクロファージの泡沫化を抑えることが動脈硬化病巣そのものの退縮が期待できるとされている。粥状動脈硬化症の病巣にマクロファージ由来の泡沫細胞 (コレステロールエステルを脂肪滴として細胞内に貯蔵している) が観察され、このマクロファージの泡沫化が病変の進展に深く関わっているとされている。また、動脈硬化病変部位の血管壁の A C A T 活性が高くなっており、血管壁にコレステロールエステルが蓄積していることが報告されている (ギリズ, ジェーら, Exp. Mole. Pathol., 44, 329-339 (1986) 参照)。

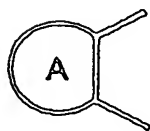
A C A T 阻害剤によるコレステロールのエステル化の阻害は細胞内に遊離コレステロールを産みだし、これが高比重リポ蛋白質 (H D L) により取り去られ肝

臓に運ばれて（HDLによる逆転送）代謝されるので病変部位でのコレステロールエステルの蓄積が抑制されることが期待される。この結果、直接的な抗動脈硬化作用が得られると考えられる。ACATには小腸に存在するタイプと血管壁に存在するタイプの二つのサブタイプが存在することが報告されている（キヌーネン, エムら, *Biochemistry*, 27, 7344-7350, (1988)) が、これまでのACAT阻害剤の研究の多くは小腸、肝臓に存在するタイプの酵素を用いて行われていた（トモダエイチら, *J. Antibiotics*, 47, 148-153 (1994))。本発明者らは血管壁に存在するタイプのACAT酵素を選択的に阻害する薬剤がより副作用の少ない動脈硬化治療剤に成りうると考え、そのような阻害剤の合成、探索を行った。

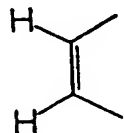
本発明者らは、この目的を達成するため研究を続けた結果、先に一般式（IV）



（式中、



は、置換基を有していてもよいベンゼン、ビリジン、シクロヘキサン、又はナフタレンの2価残基、又は基



を示し、

Arは、置換基を有していてもよいアリール基を示し、

Xは、-NH-、酸素原子又は硫黄原子を示し、

Yは、-NR₄-、酸素原子、硫黄原子、スルホキシド又はスルホンを示し、

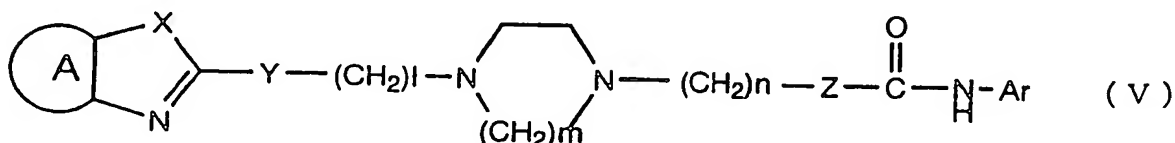
Zは、単結合又は-NR₅-を示し、

R₄は、水素原子、低級アルキル基、アリール基又は置換基を有していてもよいシリル低級アルキル基を示し、

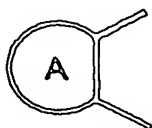
R₅は、水素原子、低級アルキル基、アリール基又は置換基を有していてもよいシリル低級アルキル基を示し、

nは、0乃至15の整数を示す。）

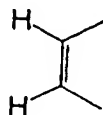
で表される化合物、これらの塩又はこれらの溶媒和物、及び、一般式 (V)



(式中、



は、置換基を有していてもよいベンゼン、ピリジン、シクロヘキサン、又はナフタレンの2価残基、又は基



を示し、

Arは、置換基を有していてもよいアリール基を示し、

Xは、-NH-、酸素原子又は硫黄原子を示し、

Yは、-NR₄-、酸素原子、硫黄原子、スルホキシド又はスルホンを示し、

Zは、単結合又は-NR₅-を示し、

R₄は、水素原子、低級アルキル基、アリール基又は置換基を有していてもよいシリル低級アルキル基を示し、

R_sは、水素原子、低級アルキル基、アリール基又は置換基を有していてもよいシリル低級アルキル基を示し、

l は、0乃至15の整数を示し、

mは、2又は3の整数を示し、

nは、0乃至3の整数を示す。）

で表される化合物、これらの塩又はこれらの溶媒和物が優れたACAT阻害作用を有することを見出し、特許出願してきた（特願平9—88660号、同9—90146号及び同9—149892号）。

また、前記式(I)で表される化合物に類似した化合物としては、3-(ベンゾチアゾール-2-イルチオ)-N-(フェニル)プロパナミドが、J. Chem. Eng. Data, 27, 207 (1982) に、3-(ベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-(フェニル)プロパナミドが、Fungitsidy, Ed. Melnikov, N. N. Izd. Fan Uzb. SSR: Tashkent, USSR, 82-88 (1980) に開示されている。しかしながら、これらの化合物はいずれもアミド部分がフェニル基である化合物であるばかりでなく、ACAT阻害作用を有することは全く開示されていない。

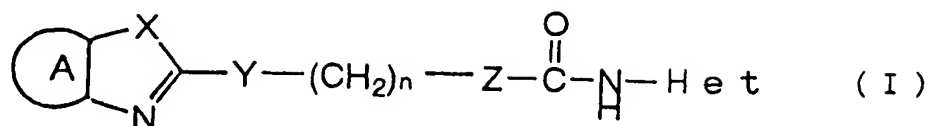
このように、本発明者らは、これらの式(IV)又は式(V)で表される化合物が臓器選択的なACAT阻害作用及び細胞内コレステロール輸送阻害作用を有し、血中コレステロール低下作用を有する抗高脂血症剤として、さらにマクロファージ泡沫化抑制作用を有する動脈硬化症などの予防、治療剤として有用な化合物であることを見出してきた。

しかしながら、これらの式(IV)又は式(V)で表される化合物はその作用が必ずしも十分なものではなく、また、臓器選択性についても満足なものではなかった。

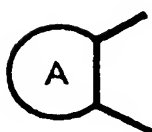
そこで、本発明者等は、さらに優れたACAT阻害作用を有するACAT阻害剤の開発をすべく、更に研究を行なった結果、前記一般式(I)で表される化合物が上記欠点を克服した有用なACAT阻害剤であることを見出し、本発明を完成した。

発明の開示

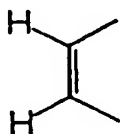
本発明は、前記一般式 (I)



(式中、



は、置換基を有していてもよいベンゼン、ピリジン、シクロヘキサン、又はナフタレンの2価残基、又は、基



を示し、

Hetは、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群から選ばれる少なくとも1個の異種原子を含有する5～8員の置換又は非置換の単環式、多環式又は縮合環式の複素環を示し、

Xは、 $-\text{NH}-$ 、酸素原子又は硫黄原子を示し、

Yは、 $-\text{NR}_4-$ 、酸素原子、硫黄原子、スルホキッド又はスルホンを示し、

Zは、単結合又は $-\text{NR}_s-$ を示し、

R_4 は、水素原子、低級アルキル基、アリール基又は置換基を有していてもよいシリル低級アルキル基を示し、

R_s は、水素原子、低級アルキル基、アリール基又は置換基を有していてもよいシリル低級アルキル基を示し、

nは、1乃至15の整数を示す。)

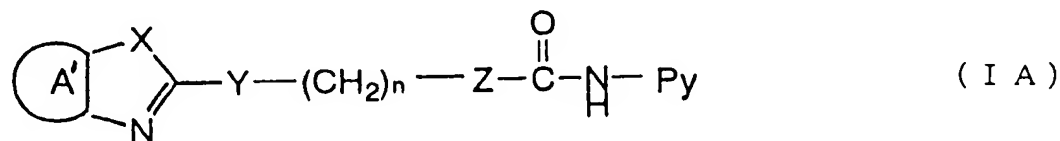
で表される化合物、これらの塩又はこれらの溶媒和物を提供するものである。

また、本発明は、治療上有効な量の前記一般式（I）で表される化合物、これらの塩又はこれらの溶媒和物の少なくとも1種、及び、製薬上許容される担体を含有してなる医薬組成物を提供するものである。

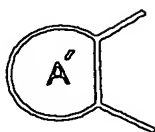
さらに、本発明は、治療上有効な量の前記一般式（I）で表される化合物、これらの塩又はこれらの溶媒和物の少なくとも1種、及び、製薬上許容される担体を含有してなるACAT阻害剤、細胞内コレステロール輸送阻害剤、血中コレステロール低下剤、又は、マクロファージ泡沫化抑制剤を提供するものである。すなわち、本発明は、治療上有効な量の前記一般式（I）で表される化合物、これらの塩又はこれらの溶媒和物の少なくとも1種、及び、製薬上許容される担体を含有してなる、高脂血症、動脈硬化症、頸部及び脳動脈硬化症、脳血管障害、虚血性心疾患、冠状動脈硬化症、腎硬化症、動脈硬化性腎硬化症、細動脈硬化性腎硬化症、悪性腎硬化症、虚血性腸疾患、急性腸管膜血管閉塞症、慢性腸管アンギーナ、虚血性大腸炎、大動脈瘤、閉塞性動脈硬化症（ASO）などの疾患の治療、予防剤を提供し、これらの予防、治療剤を用いた予防、治療方法を提供するものである。

発明を実施するための最良の形態

本発明の前記一般式（I）で表される化合物のより好ましいものとしては、次の一般式（IA）、



（式中、



は、置換基を有していてもよいベンゼン又はピリジンの2価残基を示し、

Pyは、置換基を有していてもよいピリジル基又はピリミジル基を示し、

Xは、 $-NH-$ 、酸素原子又は硫黄原子を示し、

Yは、 $-NR_4-$ 、酸素原子、硫黄原子、スルホキシド又はスルホンを示し、

Zは、単結合又は $-NR_s-$ を示し、

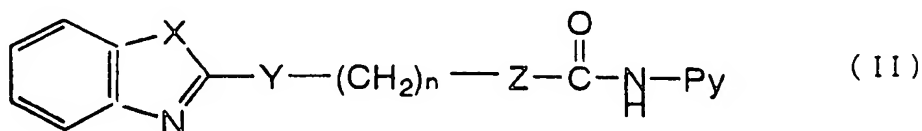
R_4 は、水素原子、低級アルキル基、アリール基又は置換基を有していてもよいシリル低級アルキル基を示し、

R_s は、水素原子、低級アルキル基、アリール基又は置換基を有していてもよいシリル低級アルキル基を示し、

nは、1乃至15の整数を示す。）

で表される化合物、これらの塩又はこれらの溶媒和物を挙げることができる。

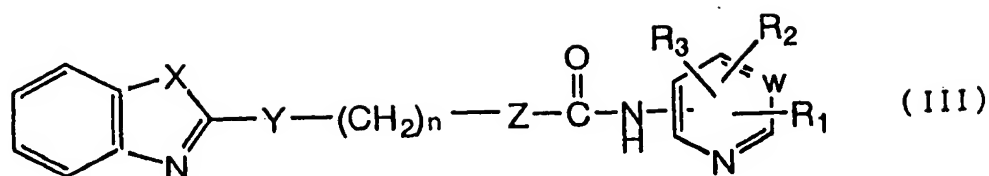
本発明の前記一般式(I)で表される化合物のさらに好ましいものとしては、次の一般式(II)、



(式中、Pyは置換基を有していてもよいピリジル基又はピリミジル基を示し、他の置換基は前記の一般式(I)で説明したものと同一ものを示す。)

で表される化合物、それらの塩又はそれらの溶媒和物をあげることができる。

さらに、本発明の前記一般式(I)で表される化合物のさらに好ましいものとしては、次の一般式(III)、



(式中、Wは、基 = CH—、又は、基 = N—を示し、

R₁、R₂及びR₃は、同一又は異なって、水素原子、低級アルキル基、低級アルコキシ基、ハロゲン原子、水酸基、リン酸基、スルホンアミド基、低級アルキルチオ基、置換基を有していてもよいアミノ基、又は、R₁、R₂、R₃のいずれか2個が一緒になってアルキレンジオキシ基を示す。)

で表される化合物が挙げられる。

本発明の一般式(I)で表される化合物の中の置換基Hetは、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群から選ばれる少なくとも1個の異種原子を含有する5～8員の置換又は非置換の複素環からなり、当該複素環は単環式であってもよいが、これらの複素環が相互に又は6員芳香環などの炭素環と直接又は炭素鎖等を介して結合した多環式であってもよく、また、これらの複素環が相互に又は6員芳香環などの炭素環と縮合した縮合環式のものであってもよい。これらの複素環の中では、1個又は2個の窒素原子を含有する5～8、好ましくは5～6員の複素環が好ましい。好ましい置換基Hetとしては、例えば、置換又は非置換のビリジル基、置換又は非置換のビリミジル基、置換又は非置換のインドール基、置換又は非置換のキノリル基などが挙げられ、置換又は非置換のビリジル基、置換又は非置換のビリミジル基が更に好ましい。

これらの複素環は、非置換のものであってもよいが、1個又は2個以上の置換基を有するものも好ましい。これらの複素環の置換基としては、本発明のACAT阻害活性を損なわないものであれば特に制限はないが、低級アルキル基、低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、低級アルキルカルボニル基、ハロゲン原子、アミノ基、低級アルキル基などで置換されたアミノ基、フェニル基又はナフチル基のような置換又は非置換のアリール基、ベンジル基又はフェネチル基のような置換又は非置換のアラルキル基などが好ましい。また、2個の置換基が連結して、

メチレンジオキシ基などのアルキレンジオキシ基となってもよい。

低級アルキル基としては、炭素数 1 ～ 10、好ましくは 1 ～ 6 の直鎖状又は分枝鎖状のものが好ましく、例えば、メチル基、エチル基、*n*-プロピル基、*iso*-プロピル基、*n*-ブチル基、*iso*-ブチル基、*tert*-ブチル基、*n*-ペンチル基、*n*-ヘキシル基等が特に好ましい。

低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基及び低級アルキルカルボニル基などの低級アルキル基としては、前記のような炭素数 1 ～ 10、好ましくは 1 ～ 6 の直鎖状又は分枝鎖状の低級アルキル基からなるものが好ましい。例えば、メトキシ基、エトキシ基、*n*-プロポキシ基、*iso*-プロポキシ基、*n*-ブトキシ基、*iso*-ブトキシ基、*tert*-ブトキシ基、*n*-ペンチルオキシ基、*n*-ヘキシルオキシ基、メチルチオ基、エチルチオ基、*n*-プロピルチオ基、*iso*-プロピルチオ基、*n*-ブチルチオ基、*iso*-ブチルチオ基、*tert*-ブチルチオ基、*n*-ペンチルチオ基、*n*-ヘキシルチオ基、メチルカルボニル基、エチルカルボニル基、*n*-プロピルカルボニル基、*iso*-プロピルカルボニル基、*n*-ブチルカルボニル基、*iso*-ブチルカルボニル基、*tert*-ブチルカルボニル基、*n*-ペンチルカルボニル基、*n*-ヘキシルカルボニル基等が挙げられる。

ハロゲン原子としては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子等が好ましい。

アリール基としては、炭素数が 6 ～ 20 個、好ましくは 6 ～ 10 個のアリール基であり、当該アリール基は非置換であってもよいが、前記した低級アルキル基、低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、低級アルキルカルボニル基、ハロゲン原子、アミノ基、低級アルキル基などで置換されたアミノ基などで置換されていてもよい。好ましいアリール基としては、フェニル基、ナフチル基、2-メトキシフェニル基、4-メチルチオフェニル基などが挙げられる。

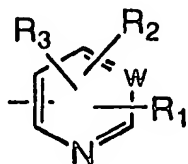
アラルキル基としては、炭素数が 7 ～ 20 個、好ましくは 7 ～ 12 個のアラルキル基であり、当該アラルキル基は非置換であってもよいが、前記した低級アルキル基、低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、低級アルキルカルボニル基、ハロゲン原子、アミノ基、低級アルキル基などで置換されたアミノ基などで置換されていてもよい。好ましいアラルキル基としては、ベンジル基、フェネチル基、

4-メチルベンジル基などが挙げられる。

置換されたアミノ基における置換基としては、前記した低級アルキル基、低級アルキルカルボニル基、アリール基、アラルキル基などが挙げられ、アミノ基の置換基は1個でもよいが2個であってもよい。好ましい置換されたアミノ基としては、メチルアミノ基、エチルアミノ基、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、アセチルアミノ基、ベンジルアミノ基などが挙げられる。

アルキレンジオキシ基のアルキレン基としては、炭素数が1～10個、好ましくは1～5個の直鎖状又は分枝鎖状のアルキレン基であり、メチレンジオキシ基やエチレンジオキシ基などが好ましい。

好ましいHet基としては、次式(VI)



(式中のW、R₁、R₂及びR₃は、前記したものを示す。)

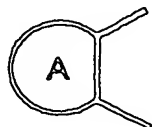
で表される基が挙げられる。より好ましいHet基としては、

- 2-メチルチオ-3-ピリジル基、
- 2-エチルチオ-3-ピリジル基、
- 2-(i s o-プロピルチオ)-3-ピリジル基、
- 2-メトキシ-3-ピリジル基、
- 2-クロロ-3-ピリジル基、
- 2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル基、
- 2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル基、
- 2-(i s o-プロピルチオ)-4-メチル-3-ピリジル基、
- 2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル基、
- 2, 6-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル基、
- 2, 6-ビス(エチルチオ)-3-ピリジル基、
- 2, 6-ビス(i s o-プロピルチオ)-3-ピリジル基、

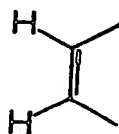
- 2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル基、
- 2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル基、
- 2-(i s o-プロピルチオ)-6-メトキシ-3-ピリジル基、
- 2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル基、
- 2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル基、
- 2-(i s o-プロピルチオ)-6-メチル-3-ピリジル基、
- 2, 6-ジメトキシ-3-ピリジル基、
- 2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル基、
- 2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル基、
- 2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル基、
- 2-メチル-6-(i s o-プロピルチオ)-3-ピリジル基、
- 2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル基、
- 2, 6-ジメチル-3-ピリジル基、
- 2, 6-ジエチル-3-ピリジル基、
- 2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル基、
- 2, 4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル基、
- 2, 4-ビス(i s o-プロピルチオ)-6-メチル-3-ピリジル基、
- 2, 4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル基、
- 2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル基、
- 4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル基、
- 2, 4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル基、
- 4, 6-ビス(メチルチオ)-5-ピリミジル基、
- 4, 6-ビス(エチルチオ)-5-ピリミジル基、
- 4, 6-ビス(i s o-プロピルチオ)-5-ピリミジル基、
- 4, 6-ジメトキシ-5-ピリミジル基、
- 4, 6-ジクロロ-2-メチル-5-ピリミジル基、
- 4, 6-ビス(ジメチルアミノ)-5-ピリミジル基、
- 4, 6-ビス(メチルチオ)-2-メチル-5-ピリミジル基、
- 2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル基、

4-メチル-6-メチルチオ-3-ビリジル基、
 5-メチルチオ-2-ビリジル基、
 2, 4, 6-トリス(メチルチオ)-5-ビリミジル基、
 などを挙げることができる。

本発明の一般式(I)で表される化合物の中の置換基



は、アゾール環を形成する2個の炭素原子と形成されるアゾール環に隣接する2価の基を示すものであり、置換基を有していてもよいベンゼン、ビリジン、シクロヘキサン、又はナフタレンの2価残基、又は、基



が好ましい。より好ましくは置換基を有していてもよいベンゼン又はビリジンの2価の残基が挙げられる。これらの2価の残基は置換基を有してもよく、当該置換基としては、前記した低級アルキル基、低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、低級アルキルスルホニル基、低級アルキルカルボニル基、ハロゲン原子、アミノ基、低級アルキル基などで置換されたアミノ基、フェニル基又はナフチル基のような置換又は非置換のアリール基、ベンジル基又はフェネチル基のような置換又は非置換のアラルキル基などが挙げられる。また、2個の置換基が連結して、メチレンジオキシ基などのアルキレンジオキシ基となってもよい。

本発明の一般式(I)で表される化合物の中の置換基Xは、-NH-、酸素原子又は硫黄原子を示し、前記の置換基と一緒にあって、イミダゾール、オキサゾール、又は、チアゾールのアゾール環が形成される。

また、本発明の一般式（I）で表される化合物の中の置換基 Y は、 $-NR_4-$ 、酸素原子、硫黄原子、スルホキシド又はスルホンを示し、窒素原子の置換基 R_4 は、水素原子、低級アルキル基、アリール基又は置換基を有していてもよいシリル低級アルキル基を示す。置換基 R_4 の低級アルキル基又はアリール基としては、前記したものであり、例えば、メチル基、エチル基、フェニル基などが挙げられる。置換基 R_4 における置換基を有していてもよいシリル低級アルキル基の、低級アルキル基は前記したものでよく、シリル低級アルキル基の置換基としては前記した低級アルキル基、アリール基、アラルキル基などが挙げられ、例えば、トリメチルシリルメチル基、ジメチルフェニルシリルメチル基などが好ましい。

置換基 Y の中では、硫黄原子が好ましい。

本発明の一般式（I）で表される化合物の中の置換基 Z は、単結合、又は、 $-NR_5-$ を示し、窒素原子の置換基 R_5 は、水素原子、低級アルキル基、アリール基又は置換基を有していてもよいシリル低級アルキル基を示し、これらの置換基は前記のものと同様である。

本発明の一般式（I）で表される化合物の中の繰り返し単位数の n は、1～15 の整数、好ましくは 1～9 の整数を示す。繰り返される単位としては、一般式（I）では、メチレン基を挙げているが、本発明の A C A T 阻害活性を損なわないのであれば、これらのメチレン基は置換基を有してもよいし、1 個又は 2 個以上のメチレン単位が、窒素原子、酸素原子又は硫黄原子などの異種原子に置き換えられてもよい。

本発明の一般式（II）で表される化合物の中の置換基 X、Y、Z 及び繰り返し単位は前記したものであり、置換基 P_y は、置換基を有していてもよいピリジル基又はピリミジル基を示し、ピリジル基又はピリミジン基の置換基としては、本発明の A C A T 阻害活性を損なわないものであれば特に制限はないが、前記一般式（VI）で表されるものが好ましい。

本発明の一般式（III）で表される化合物の中の置換基 X、Y、Z 及び繰り返し単位は前記したものであり、置換基 W は炭素原子又は窒素原子を示し、ピリジン環又はピリミジン環を形成するものである。また、置換基 R_1 、 R_2 及び R_3 は、同一又は異なって、水素原子、低級アルキル基、低級アルコキシ基、ハロゲン原子、

水酸基、リン酸基、スルホンアミド基、低級アルキルチオ基、置換基を有していてもよいアミノ基、又は、 R_1 、 R_2 、 R_3 のいずれか2個が一緒になってアルキレンジオキシ基を示し、これらの基のうちの低級アルキル基、低級アルコキシ基、ハロゲン原子、低級アルキルチオ基、置換基を有していてもよいアミノ基、又は、アルキレンジオキシ基は前記したものである。置換基 R_1 、 R_2 及び R_3 の好ましいものとしては、メチル基、エチル基、*i* s o -プロピル基、メトキシ基、エトキシ基、*i* s o -プロポキシ基、塩素、メチルチオ基、エチルチオ基、*i* s o -プロピルチオ基、ジメチルアミノ基などが挙げられる。また、ピリジン環やピリミジン環の隣接する窒素原子への結合位置も、本発明のA C A T阻害活性を損なわない限り特に制限はない。

本発明の一般式(I)、(II)又は(III)で表される化合物の塩としては、本発明のA C A T阻害活性を損なわないものであれば特に制限はなく、必要に応じて酸付加塩又は塩基付加塩とすることができる。好ましい酸付加塩としては、例えば、塩酸塩、硫酸塩、硝酸塩、リン酸塩等の無機酸塩及びメタンスルホン酸塩、マレイン酸塩、フマル酸塩、クエン酸塩等の有機酸塩などが挙げられる。

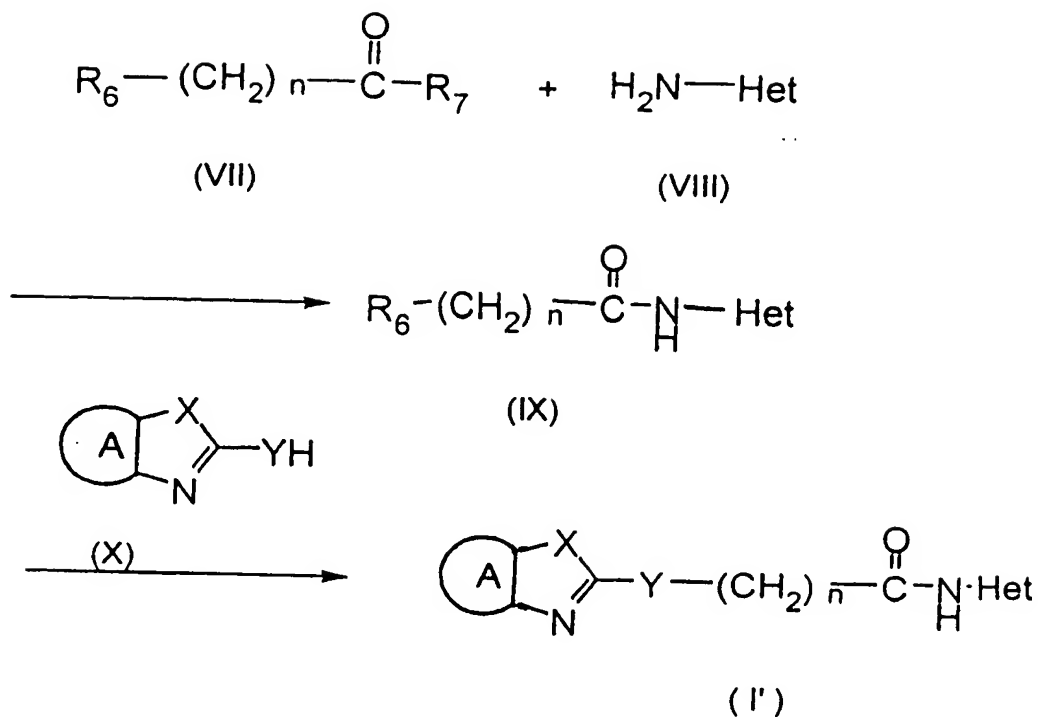
また、本発明の一般式(I)、(II)又は(III)で表される化合物の溶媒和物としては、製造時、精製時などに用いた溶媒、例えば、水、アルコールなどが付加したものであり、A C A T阻害作用などに悪影響を及ぼさないものであれば特に制限されるものではない。溶媒和物としては水和物が好ましい。

次に本発明の化合物の製造方法について説明する。

化合物(I)は種々の公知の方法で製造することができ、特に制限されるものではなく、例えば、次の反応工程に従い製造することができる。

1. 置換基Zが単結合である場合の一般式(I)の化合物の製法。

次に示す反応式に従って、



(式中、R₆は脱離基を、R₇は水酸基又はカルボン酸基の反応性誘導体残基を示す。)

一般式(VII)で示されるカルボン酸又はその反応性誘導体、例えば、酸ハロゲン化物などと、一般式(VIII)で示される複素環式アミンとを反応させて、一般式(IX)で示されるアミド誘導体を得られる。得られた一般式(IX)で示される化合物に、一般式(X)で示されるアゾール誘導体を反応させると、目的の一般式(I)における置換基Zが単結合を示す化合物(I')を製造することができる。

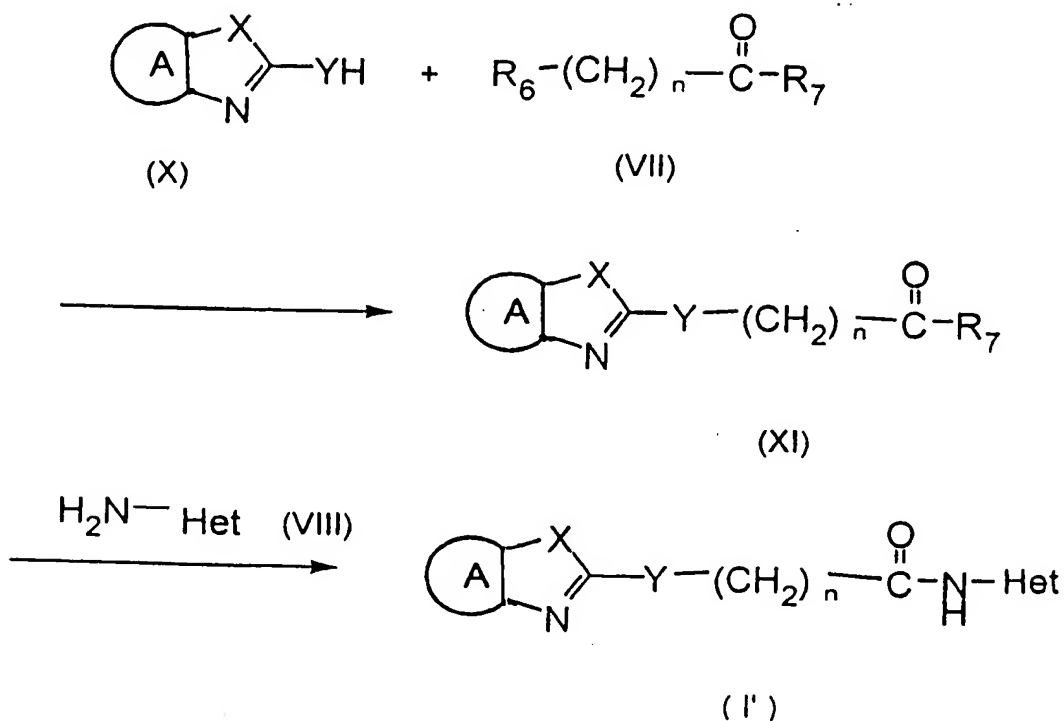
化合物 (V I I) と化合物 (V I I I) の反応は、通常のペプチド合成に用いられている方法を適用することができる。一般式 (V I I) の脱離基 R_6 としては、例えば、塩素原子、臭素原子などのハロゲン原子などが、 R_7 の反応性誘導体残基としては、例えば、メシル酸、トシル酸、酢酸、ピバロイル酸などとの酸無水物残基などが好ましい。この反応をさらに具体的に説明すれば、縮合剤の存在下に両化合物を溶媒中で反応させることによって目的化合物を得ることができる。縮合剤としては、例えば、1-(3'-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド (WSC)、1, 3-ジシクロヘキシルカルボジイミド (DCC) などを単独で使用してもよいが、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール (HOBt)、N-ヒドロキシスクシンイミド (HOSu) などを組み合わせて使用することもできる。溶媒としては、特に制限はないが、例えば、ジメチルホルムアミド、塩化メチレン、クロロホルム、テトラヒドロフラン、トルエン等を単独または組み合わせて使用することができる。反応は使用する原料によって異なるが、一般には 0 ~ 100℃、好ましくは室温付近で、1 ~ 30 時間、好ましくは 10 ~ 20 時間反応させることによって終了する。また、化合物 (V I I) として、反応性の高いカルボン酸ハロゲン化物を使用するときは、例えば、化合物 (V I I) と化合物 (V I I I) とを塩基、例えば、トリエチルアミン、4-ジメチルアミノピリジン、又は、N-メチルモルホリンの存在下に通常の方法で反応させることができる。

出発化合物 (V I I) 及び (V I I I) は、例えば、化合物 (V I I) は、ハロアルキルアルコールをジョーンズ試薬等でカルボン酸に酸化する方法、化合物 (V I I I) は複素環化合物のニトロ化物を接触還元等の還元反応に付して相当するアミノ複素環式化合物を得る方法などで製造することができる。

上記の方法で得られた化合物 (I X) と化合物 (X) との反応は溶媒中、塩基の存在下又は非存在下で行うことができる。溶媒としては前記の様なものを使用でき、塩基としては、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等の水酸化アルカリ金属類；炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の炭酸アルカリ金属類；炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の炭酸水素アルカリ金属類などの無機塩基、ピリジン、トリエチルアミン、N, N-ジイソプロピルエチルアミン、N-メチルモ

ルホリン、N, N-ジメチルアニリンなどの有機塩基を使用することができる。

また、目的とする一般式 (I') で表される化合物は次式に示す反応、



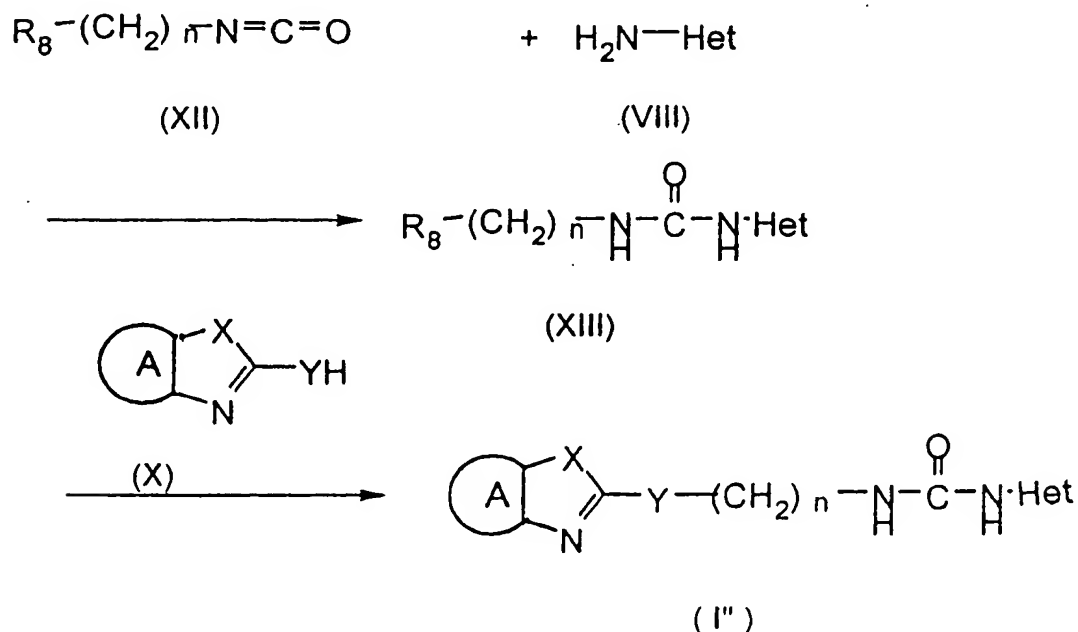
(式中、R₆は脱離基を、R₇は水酸基又はカルボン酸基の反応性誘導体残基を示す。)

に従って、一般式 (X) で示されるアゾール誘導体と、一般式 (VII) で示される化合物の遊離のカルボン酸又はカルボン酸の不活性体と反応させて、一般式 (XI) で示されるカルボン酸誘導体を得る。得られた一般式 (XI) で示される化合物又はその反応性誘導体、例えば、酸ハロゲン化物と一般式 (VIII) で示される複素環式アミン誘導体とを反応させると、目的の一般式 (I') における置換基 Z が単結合を示す化合物 (I') を製造することができる。

化合物 (X) と化合物 (V I I) との反応は、前記の反応式の第二工程に準じて行うことができるが、塩基として水酸化カリウム、溶媒としてエタノールを用いる反応が特に好ましい。得られた化合物 (X I) と化合物 (V I I I) との反応は前記の反応式の第一工程に準じて行うことができる。

2. 置換基 Z が -NH- である場合の一般式 (I) の化合物の製法。

Z が -NH- を示す場合の一般式 (I) で示される化合物は、種々の方法で製造しうるが、次の反応式で示される方法により製造するのが好ましい。



(式中、R₈は、脱離基を示す。)

一般式 (X I I) で示されるイソシアネート誘導体と一般式 (V I I I) で示される複素環式アミンとを反応させることにより、一般式 (X I I I) で示される尿素誘導体を得られる。得られた尿素誘導体に、化合物 (X) を反応させることにより、目的とする一般式 (I) における置換基 Z が -NH- を示す化合物 (I'') が得られる。

この反応式の第一工程の化合物 (X I I) と化合物 (V I I I) との反応は、化合物 (X I I) に対して 1 ~ 2 当量の化合物 (V I I I) を、溶媒中で反応させることにより化合物 (X I I I) が得られる。この際の溶媒としては、特に制限はないが、例えば、塩化メチレン、クロロホルム、エーテル、テトラヒドロフラン、トルエン、キシレン、ジメチルホルムアミドなどを使用することが好ましい。反応は、0℃から用いた溶媒の沸点で、反応時間は 1 ~ 24 時間くらいで進行する。

一般式 (X I I) で示されるイソシアネート誘導体は公知化合物であり、例えば、前記した化合物 (V I I) のカルボン酸に、塩基の存在下、アジ化ジフェニルホスホリルを反応させる方法（塩入らの方法）、化合物 (V I I) の酸ハロゲン化物とアジ化ナトリウムを反応させ酸アジドを経由する方法などで製造することができる。

化合物 (X I I I) と化合物 (X) の反応は、前記した反応式の第二工程に準じて行うことができる。

また、一般式 (I) の置換基 Z が、 $-NR_s-$ (R_s は、前記した定義の水素原子以外の基を示す。) の場合には、適当な段階で窒素原子を置換基 R_s で置換することにより製造することができる。

前記の各反応で得られた中間体および目的化合物は、有機合成化学で常用される精製法、例えば、濾過、抽出、洗浄、乾燥、濃縮、再結晶、各種クロマトグラフィー等に付して単離、精製することができる。また、各中間体は、次の工程に支障がなければ、特に精製することなく次の反応に供することは、当業者にはよく知られていることである。

得られた化合物 (I) は通常の方法で、本発明の塩とすることができる。

また、反応溶媒、再結晶溶媒などの溶媒の溶媒和物、特に水和物とすることも通常の方法により行えることは当業者によく知られていることである。

本発明の方法により得られる一般式 (I)、(I I) 又は (I I I) で表される化合物を次の表 1 から表 78 に例示する。


[表 1]

化合物 番号		X	Y	Z	n	H e t
1		O	S	単結合	1	2-メチルチオ-3-ピリジル
2	同上	O	S	単結合	2	2-メチルチオ-3-ピリジル
3	同上	O	S	単結合	3	2-メチルチオ-3-ピリジル
4	同上	O	S	単結合	4	2-メチルチオ-3-ピリジル
5	同上	O	S	単結合	5	2-メチルチオ-3-ピリジル
6	同上	O	S	単結合	6	2-メチルチオ-3-ピリジル
7	同上	O	S	単結合	7	2-メチルチオ-3-ピリジル
8	同上	O	S	単結合	8	2-メチルチオ-3-ピリジル
9	同上	O	S	単結合	9	2-メチルチオ-3-ピリジル
10	同上	O	S	単結合	14	2-メチルチオ-3-ピリジル
11	同上	S	S	単結合	1	2-メチルチオ-3-ピリジル
12	同上	S	S	単結合	2	2-メチルチオ-3-ピリジル
13	同上	S	S	単結合	3	2-メチルチオ-3-ピリジル
14	同上	S	S	単結合	4	2-メチルチオ-3-ピリジル
15	同上	S	S	単結合	5	2-メチルチオ-3-ピリジル
16	同上	S	S	単結合	6	2-メチルチオ-3-ピリジル
17	同上	S	S	単結合	7	2-メチルチオ-3-ピリジル
18	同上	S	S	単結合	8	2-メチルチオ-3-ピリジル
19	同上	S	S	単結合	9	2-メチルチオ-3-ピリジル
20	同上	S	S	単結合	14	2-メチルチオ-3-ピリジル

[表 2]

化合物 番号		X	Y	Z	n	H e t
2 1		NH	S	単結合	1	2-メチルチオ-3-ピリジル
2 2	同上	NH	S	単結合	2	2-メチルチオ-3-ピリジル
2 3	同上	NH	S	単結合	3	2-メチルチオ-3-ピリジル
2 4	同上	NH	S	単結合	4	2-メチルチオ-3-ピリジル
2 5	同上	NH	S	単結合	5	2-メチルチオ-3-ピリジル
2 6	同上	NH	S	単結合	6	2-メチルチオ-3-ピリジル
2 7	同上	NH	S	単結合	7	2-メチルチオ-3-ピリジル
2 8	同上	NH	S	単結合	8	2-メチルチオ-3-ピリジル
2 9	同上	NH	S	単結合	9	2-メチルチオ-3-ピリジル
3 0	同上	NH	S	単結合	1 4	2-メチルチオ-3-ピリジル
3 1	同上	O	S	単結合	1	2-エチルチオ-3-ピリジル
3 2	同上	O	S	単結合	2	2-エチルチオ-3-ピリジル
3 3	同上	O	S	単結合	3	2-エチルチオ-3-ピリジル
3 4	同上	O	S	単結合	4	2-エチルチオ-3-ピリジル
3 5	同上	O	S	単結合	5	2-エチルチオ-3-ピリジル
3 6	同上	O	S	単結合	6	2-エチルチオ-3-ピリジル
3 7	同上	O	S	単結合	7	2-エチルチオ-3-ピリジル
3 8	同上	O	S	単結合	8	2-エチルチオ-3-ピリジル
3 9	同上	O	S	単結合	9	2-エチルチオ-3-ピリジル
4 0	同上	O	S	単結合	1 4	2-エチルチオ-3-ピリジル

[表 3]

化合物 番号		X	Y	Z	n	H e t
4 1		S	S	単結合	1	2-エチルチオ-3-ピリジル
4 2	同上	S	S	単結合	2	2-エチルチオ-3-ピリジル
4 3	同上	S	S	単結合	3	2-エチルチオ-3-ピリジル
4 4	同上	S	S	単結合	4	2-エチルチオ-3-ピリジル
4 5	同上	S	S	単結合	5	2-エチルチオ-3-ピリジル
4 6	同上	S	S	単結合	6	2-エチルチオ-3-ピリジル
4 7	同上	S	S	単結合	7	2-エチルチオ-3-ピリジル
4 8	同上	S	S	単結合	8	2-エチルチオ-3-ピリジル
4 9	同上	S	S	単結合	9	2-エチルチオ-3-ピリジル
5 0	同上	S	S	単結合	1 4	2-エチルチオ-3-ピリジル
5 1	同上	NH	S	単結合	1	2-エチルチオ-3-ピリジル
5 2	同上	NH	S	単結合	2	2-エチルチオ-3-ピリジル
5 3	同上	NH	S	単結合	3	2-エチルチオ-3-ピリジル
5 4	同上	NH	S	単結合	4	2-エチルチオ-3-ピリジル
5 5	同上	NH	S	単結合	5	2-エチルチオ-3-ピリジル
5 6	同上	NH	S	単結合	6	2-エチルチオ-3-ピリジル
5 7	同上	NH	S	単結合	7	2-エチルチオ-3-ピリジル
5 8	同上	NH	S	単結合	8	2-エチルチオ-3-ピリジル
5 9	同上	NH	S	単結合	9	2-エチルチオ-3-ピリジル
6 0	同上	NH	S	単結合	1 4	2-エチルチオ-3-ピリジル


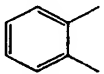
[表 4]

化合物 番号		X	Y	Z	n	H e t
6 1		O	S	単結合	1	2-(i-プロピルチオ)-3-ピリジル
6 2	同上	O	S	単結合	2	2-(i-プロピルチオ)-3-ピリジル
6 3	同上	O	S	単結合	3	2-(i-プロピルチオ)-3-ピリジル
6 4	同上	O	S	単結合	4	2-(i-プロピルチオ)-3-ピリジル
6 5	同上	O	S	単結合	5	2-(i-プロピルチオ)-3-ピリジル
6 6	同上	O	S	単結合	6	2-(i-プロピルチオ)-3-ピリジル
6 7	同上	O	S	単結合	7	2-(i-プロピルチオ)-3-ピリジル
6 8	同上	O	S	単結合	8	2-(i-プロピルチオ)-3-ピリジル
6 9	同上	O	S	単結合	9	2-(i-プロピルチオ)-3-ピリジル
7 0	同上	O	S	単結合	1 4	2-(i-プロピルチオ)-3-ピリジル
7 1	同上	S	S	単結合	1	2-(i-プロピルチオ)-3-ピリジル
7 2	同上	S	S	単結合	2	2-(i-プロピルチオ)-3-ピリジル
7 3	同上	S	S	単結合	3	2-(i-プロピルチオ)-3-ピリジル
7 4	同上	S	S	単結合	4	2-(i-プロピルチオ)-3-ピリジル
7 5	同上	S	S	単結合	5	2-(i-プロピルチオ)-3-ピリジル
7 6	同上	S	S	単結合	6	2-(i-プロピルチオ)-3-ピリジル
7 7	同上	S	S	単結合	7	2-(i-プロピルチオ)-3-ピリジル
7 8	同上	S	S	単結合	8	2-(i-プロピルチオ)-3-ピリジル
7 9	同上	S	S	単結合	9	2-(i-プロピルチオ)-3-ピリジル
8 0	同上	S	S	単結合	1 4	2-(i-プロピルチオ)-3-ピリジル

[表 5]

化合物 番号		X	Y	Z	n	H e t
8 1		NH	S	単結合	1	2- (i -プロピルチオ) -3-ピリジル
8 2	同上	NH	S	単結合	2	2- (i -プロピルチオ) -3-ピリジル
8 3	同上	NH	S	単結合	3	2- (i -プロピルチオ) -3-ピリジル
8 4	同上	NH	S	単結合	4	2- (i -プロピルチオ) -3-ピリジル
8 5	同上	NH	S	単結合	5	2- (i -プロピルチオ) -3-ピリジル
8 6	同上	NH	S	単結合	6	2- (i -プロピルチオ) -3-ピリジル
8 7	同上	NH	S	単結合	7	2- (i -プロピルチオ) -3-ピリジル
8 8	同上	NH	S	単結合	8	2- (i -プロピルチオ) -3-ピリジル
8 9	同上	NH	S	単結合	9	2- (i -プロピルチオ) -3-ピリジル
9 0	同上	NH	S	単結合	1 4	2- (i -プロピルチオ) -3-ピリジル
9 1	同上	O	S	単結合	1	2-メトキシ-3-ピリジル
9 2	同上	O	S	単結合	2	2-メトキシ-3-ピリジル
9 3	同上	O	S	単結合	3	2-メトキシ-3-ピリジル
9 4	同上	O	S	単結合	4	2-メトキシ-3-ピリジル
9 5	同上	O	S	単結合	5	2-メトキシ-3-ピリジル
9 6	同上	O	S	単結合	6	2-メトキシ-3-ピリジル
9 7	同上	O	S	単結合	7	2-メトキシ-3-ピリジル
9 8	同上	O	S	単結合	8	2-メトキシ-3-ピリジル
9 9	同上	O	S	単結合	9	2-メトキシ-3-ピリジル
1 0 0	同上	O	S	単結合	1 4	2-メトキシ-3-ピリジル

[表 6]

化合物 番号		X	Y	Z	n	He t
1 0 1		S	S	単結合	1	2-メトキシ-3-ピリジル
1 0 2	同上	S	S	単結合	2	2-メトキシ-3-ピリジル
1 0 3	同上	S	S	単結合	3	2-メトキシ-3-ピリジル
1 0 4	同上	S	S	単結合	4	2-メトキシ-3-ピリジル
1 0 5	同上	S	S	単結合	5	2-メトキシ-3-ピリジル
1 0 6	同上	S	S	単結合	6	2-メトキシ-3-ピリジル
1 0 7	同上	S	S	単結合	7	2-メトキシ-3-ピリジル
1 0 8	同上	S	S	単結合	8	2-メトキシ-3-ピリジル
1 0 9	同上	S	S	単結合	9	2-メトキシ-3-ピリジル
1 1 0	同上	S	S	単結合	1 4	2-メトキシ-3-ピリジル
1 1 1	同上	NH	S	単結合	1	2-メトキシ-3-ピリジル
1 1 2	同上	NH	S	単結合	2	2-メトキシ-3-ピリジル
1 1 3	同上	NH	S	単結合	3	2-メトキシ-3-ピリジル
1 1 4	同上	NH	S	単結合	4	2-メトキシ-3-ピリジル
1 1 5	同上	NH	S	単結合	5	2-メトキシ-3-ピリジル
1 1 6	同上	NH	S	単結合	6	2-メトキシ-3-ピリジル
1 1 7	同上	NH	S	単結合	7	2-メトキシ-3-ピリジル
1 1 8	同上	NH	S	単結合	8	2-メトキシ-3-ピリジル
1 1 9	同上	NH	S	単結合	9	2-メトキシ-3-ピリジル
1 2 0	同上	NH	S	単結合	1 4	2-メトキシ-3-ピリジル

[表 7]

化合物 番号		X	Y	Z	n	H e t
1 2 1		O	S	単結合	1	2-クロロ-3-ピリジル
1 2 2	同上	O	S	単結合	2	2-クロロ-3-ピリジル
1 2 3	同上	O	S	単結合	3	2-クロロ-3-ピリジル
1 2 4	同上	O	S	単結合	4	2-クロロ-3-ピリジル
1 2 5	同上	O	S	単結合	5	2-クロロ-3-ピリジル
1 2 6	同上	O	S	単結合	6	2-クロロ-3-ピリジル
1 2 7	同上	O	S	単結合	7	2-クロロ-3-ピリジル
1 2 8	同上	O	S	単結合	8	2-クロロ-3-ピリジル
1 2 9	同上	O	S	単結合	9	2-クロロ-3-ピリジル
1 3 0	同上	O	S	単結合	1 4	2-クロロ-3-ピリジル
1 3 1	同上	S	S	単結合	1	2-クロロ-3-ピリジル
1 3 2	同上	S	S	単結合	2	2-クロロ-3-ピリジル
1 3 3	同上	S	S	単結合	3	2-クロロ-3-ピリジル
1 3 4	同上	S	S	単結合	4	2-クロロ-3-ピリジル
1 3 5	同上	S	S	単結合	5	2-クロロ-3-ピリジル
1 3 6	同上	S	S	単結合	6	2-クロロ-3-ピリジル
1 3 7	同上	S	S	単結合	7	2-クロロ-3-ピリジル
1 3 8	同上	S	S	単結合	8	2-クロロ-3-ピリジル
1 3 9	同上	S	S	単結合	9	2-クロロ-3-ピリジル
1 4 0	同上	S	S	単結合	1 4	2-クロロ-3-ピリジル

[表 8]

化合物 番号		X	Y	Z	n	H e t
1 4 1		NH	S	単結合	1	2-クロロ-3-ピリジル
1 4 2	同上	NH	S	単結合	2	2-クロロ-3-ピリジル
1 4 3	同上	NH	S	単結合	3	2-クロロ-3-ピリジル
1 4 4	同上	NH	S	単結合	4	2-クロロ-3-ピリジル
1 4 5	同上	NH	S	単結合	5	2-クロロ-3-ピリジル
1 4 6	同上	NH	S	単結合	6	2-クロロ-3-ピリジル
1 4 7	同上	NH	S	単結合	7	2-クロロ-3-ピリジル
1 4 8	同上	NH	S	単結合	8	2-クロロ-3-ピリジル
1 4 9	同上	NH	S	単結合	9	2-クロロ-3-ピリジル
1 5 0	同上	NH	S	単結合	1 4	2-クロロ-3-ピリジル
1 5 1	同上	O	S	単結合	1	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
1 5 2	同上	O	S	単結合	2	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
1 5 3	同上	O	S	単結合	3	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
1 5 4	同上	O	S	単結合	4	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
1 5 5	同上	O	S	単結合	5	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
1 5 6	同上	O	S	単結合	6	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
1 5 7	同上	O	S	単結合	7	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
1 5 8	同上	O	S	単結合	8	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
1 5 9	同上	O	S	単結合	9	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
1 6 0	同上	O	S	単結合	1 4	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル

[表 9]

化合物 番号		X	Y	Z	n	H e t
1 6 1		S	S	単結合	1	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
1 6 2	同上	S	S	単結合	2	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
1 6 3	同上	S	S	単結合	3	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
1 6 4	同上	S	S	単結合	4	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
1 6 5	同上	S	S	単結合	5	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
1 6 6	同上	S	S	単結合	6	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
1 6 7	同上	S	S	単結合	7	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
1 6 8	同上	S	S	単結合	8	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
1 6 9	同上	S	S	単結合	9	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
1 7 0	同上	S	S	単結合	1 4	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
1 7 1	同上	NH	S	単結合	1	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
1 7 2	同上	NH	S	単結合	2	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
1 7 3	同上	NH	S	単結合	3	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
1 7 4	同上	NH	S	単結合	4	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
1 7 5	同上	NH	S	単結合	5	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
1 7 6	同上	NH	S	単結合	6	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
1 7 7	同上	NH	S	単結合	7	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
1 7 8	同上	NH	S	単結合	8	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
1 7 9	同上	NH	S	単結合	9	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
1 8 0	同上	NH	S	単結合	1 4	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル

[表 10]

化合物 番号		X	Y	Z	n	Het
181		O	S	単結合	1	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
182	同上	O	S	単結合	2	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
183	同上	O	S	単結合	3	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
184	同上	O	S	単結合	4	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
185	同上	O	S	単結合	5	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
186	同上	O	S	単結合	6	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
187	同上	O	S	単結合	7	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
188	同上	O	S	単結合	8	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
189	同上	O	S	単結合	9	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
190	同上	O	S	単結合	14	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
191	同上	S	S	単結合	1	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
192	同上	S	S	単結合	2	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
193	同上	S	S	単結合	3	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
194	同上	S	S	単結合	4	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
195	同上	S	S	単結合	5	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
196	同上	S	S	単結合	6	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
197	同上	S	S	単結合	7	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
198	同上	S	S	単結合	8	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
199	同上	S	S	単結合	9	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
200	同上	S	S	単結合	14	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル

[表 1 1]

化合物 番号		X	Y	Z	n	H e t
2 0 1		NH	S	単結合	1	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
2 0 2	同上	NH	S	単結合	2	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
2 0 3	同上	NH	S	単結合	3	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
2 0 4	同上	NH	S	単結合	4	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
2 0 5	同上	NH	S	単結合	5	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
2 0 6	同上	NH	S	単結合	6	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
2 0 7	同上	NH	S	単結合	7	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
2 0 8	同上	NH	S	単結合	8	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
2 0 9	同上	NH	S	単結合	9	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
2 1 0	同上	NH	S	単結合	1 4	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
2 1 1	同上	O	S	単結合	1	2-(i-プロピルチオ)-4-メチル-3-ピリジル
2 1 2	同上	O	S	単結合	2	2-(i-プロピルチオ)-4-メチル-3-ピリジル
2 1 3	同上	O	S	単結合	3	2-(i-プロピルチオ)-4-メチル-3-ピリジル
2 1 4	同上	O	S	単結合	4	2-(i-プロピルチオ)-4-メチル-3-ピリジル
2 1 5	同上	O	S	単結合	5	2-(i-プロピルチオ)-4-メチル-3-ピリジル
2 1 6	同上	O	S	単結合	6	2-(i-プロピルチオ)-4-メチル-3-ピリジル
2 1 7	同上	O	S	単結合	7	2-(i-プロピルチオ)-4-メチル-3-ピリジル
2 1 8	同上	O	S	単結合	8	2-(i-プロピルチオ)-4-メチル-3-ピリジル
2 1 9	同上	O	S	単結合	9	2-(i-プロピルチオ)-4-メチル-3-ピリジル
2 2 0	同上	O	S	単結合	1 4	2-(i-プロピルチオ)-4-メチル-3-ピリジル

[表 1 2]

化合物 番号		X	Y	Z	n	H e t
2 2 1		S	S	単結合	1	2- (i -プロピルチオ) -4-メチル-3-ピリジル
2 2 2	同上	S	S	単結合	2	2- (i -プロピルチオ) -4-メチル-3-ピリジル
2 2 3	同上	S	S	単結合	3	2- (i -プロピルチオ) -4-メチル-3-ピリジル
2 2 4	同上	S	S	単結合	4	2- (i -プロピルチオ) -4-メチル-3-ピリジル
2 2 5	同上	S	S	単結合	5	2- (i -プロピルチオ) -4-メチル-3-ピリジル
2 2 6	同上	S	S	単結合	6	2- (i -プロピルチオ) -4-メチル-3-ピリジル
2 2 7	同上	S	S	単結合	7	2- (i -プロピルチオ) -4-メチル-3-ピリジル
2 2 8	同上	S	S	単結合	8	2- (i -プロピルチオ) -4-メチル-3-ピリジル
2 2 9	同上	S	S	単結合	9	2- (i -プロピルチオ) -4-メチル-3-ピリジル
2 3 0	同上	S	S	単結合	1 4	2- (i -プロピルチオ) -4-メチル-3-ピリジル
2 3 1	同上	NH	S	単結合	1	2- (i -プロピルチオ) -4-メチル-3-ピリジル
2 3 2	同上	NH	S	単結合	2	2- (i -プロピルチオ) -4-メチル-3-ピリジル
2 3 3	同上	NH	S	単結合	3	2- (i -プロピルチオ) -4-メチル-3-ピリジル
2 3 4	同上	NH	S	単結合	4	2- (i -プロピルチオ) -4-メチル-3-ピリジル
2 3 5	同上	NH	S	単結合	5	2- (i -プロピルチオ) -4-メチル-3-ピリジル
2 3 6	同上	NH	S	単結合	6	2- (i -プロピルチオ) -4-メチル-3-ピリジル
2 3 7	同上	NH	S	単結合	7	2- (i -プロピルチオ) -4-メチル-3-ピリジル
2 3 8	同上	NH	S	単結合	8	2- (i -プロピルチオ) -4-メチル-3-ピリジル
2 3 9	同上	NH	S	単結合	9	2- (i -プロピルチオ) -4-メチル-3-ピリジル
2 4 0	同上	NH	S	単結合	1 4	2- (i -プロピルチオ) -4-メチル-3-ピリジル


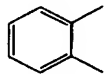
[表 1 3]

化合物 番号		X	Y	Z	n	He t
2 4 1		O	S	単結合	1	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
2 4 2	同上	O	S	単結合	2	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
2 4 3	同上	O	S	単結合	3	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
2 4 4	同上	O	S	単結合	4	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
2 4 5	同上	O	S	単結合	5	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
2 4 6	同上	O	S	単結合	6	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
2 4 7	同上	O	S	単結合	7	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
2 4 8	同上	O	S	単結合	8	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
2 4 9	同上	O	S	単結合	9	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
2 5 0	同上	O	S	単結合	1 4	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
2 5 1	同上	S	S	単結合	1	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
2 5 2	同上	S	S	単結合	2	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
2 5 3	同上	S	S	単結合	3	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
2 5 4	同上	S	S	単結合	4	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
2 5 5	同上	S	S	単結合	5	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
2 5 6	同上	S	S	単結合	6	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
2 5 7	同上	S	S	単結合	7	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
2 5 8	同上	S	S	単結合	8	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
2 5 9	同上	S	S	単結合	9	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
2 6 0	同上	S	S	単結合	1 4	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル

[表 1 4]

化合物 番号		X	Y	Z	n	H e t
2 6 1		NH	S	単結合	1	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
2 6 2	同上	NH	S	単結合	2	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
2 6 3	同上	NH	S	単結合	3	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
2 6 4	同上	NH	S	単結合	4	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
2 6 5	同上	NH	S	単結合	5	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
2 6 6	同上	NH	S	単結合	6	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
2 6 7	同上	NH	S	単結合	7	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
2 6 8	同上	NH	S	単結合	8	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
2 6 9	同上	NH	S	単結合	9	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
2 7 0	同上	NH	S	単結合	1 4	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
2 7 1	同上	O	S	単結合	1	2, 6-ビス (メチルチオ) -3-ピリジル
2 7 2	同上	O	S	単結合	2	2, 6-ビス (メチルチオ) -3-ピリジル
2 7 3	同上	O	S	単結合	3	2, 6-ビス (メチルチオ) -3-ピリジル
2 7 4	同上	O	S	単結合	4	2, 6-ビス (メチルチオ) -3-ピリジル
2 7 5	同上	O	S	単結合	5	2, 6-ビス (メチルチオ) -3-ピリジル
2 7 6	同上	O	S	単結合	6	2, 6-ビス (メチルチオ) -3-ピリジル
2 7 7	同上	O	S	単結合	7	2, 6-ビス (メチルチオ) -3-ピリジル
2 7 8	同上	O	S	単結合	8	2, 6-ビス (メチルチオ) -3-ピリジル
2 7 9	同上	O	S	単結合	9	2, 6-ビス (メチルチオ) -3-ピリジル
2 8 0	同上	O	S	単結合	1 4	2, 6-ビス (メチルチオ) -3-ピリジル

[表 15]

化合物 番号		X	Y	Z	n	Het
281		S	S	単結合	1	2,6-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル
282	同上	S	S	単結合	2	2,6-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル
283	同上	S	S	単結合	3	2,6-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル
284	同上	S	S	単結合	4	2,6-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル
285	同上	S	S	単結合	5	2,6-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル
286	同上	S	S	単結合	6	2,6-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル
287	同上	S	S	単結合	7	2,6-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル
288	同上	S	S	単結合	8	2,6-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル
289	同上	S	S	単結合	9	2,6-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル
290	同上	S	S	単結合	14	2,6-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル
291	同上	NH	S	単結合	1	2,6-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル
292	同上	NH	S	単結合	2	2,6-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル
293	同上	NH	S	単結合	3	2,6-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル
294	同上	NH	S	単結合	4	2,6-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル
295	同上	NH	S	単結合	5	2,6-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル
296	同上	NH	S	単結合	6	2,6-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル
297	同上	NH	S	単結合	7	2,6-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル
298	同上	NH	S	単結合	8	2,6-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル
299	同上	NH	S	単結合	9	2,6-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル
300	同上	NH	S	単結合	14	2,6-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル

[表 16]

化合物 番号		X	Y	Z	n	H e t
3 0 1		O	S	単結合	1	2,6-ビス (エチルチオ) -3-ピリジル
3 0 2	同上	O	S	単結合	2	2,6-ビス (エチルチオ) -3-ピリジル
3 0 3	同上	O	S	単結合	3	2,6-ビス (エチルチオ) -3-ピリジル
3 0 4	同上	O	S	単結合	4	2,6-ビス (エチルチオ) -3-ピリジル
3 0 5	同上	O	S	単結合	5	2,6-ビス (エチルチオ) -3-ピリジル
3 0 6	同上	O	S	単結合	6	2,6-ビス (エチルチオ) -3-ピリジル
3 0 7	同上	O	S	単結合	7	2,6-ビス (エチルチオ) -3-ピリジル
3 0 8	同上	O	S	単結合	8	2,6-ビス (エチルチオ) -3-ピリジル
3 0 9	同上	O	S	単結合	9	2,6-ビス (エチルチオ) -3-ピリジル
3 1 0	同上	O	S	単結合	1 4	2,6-ビス (エチルチオ) -3-ピリジル
3 1 1	同上	S	S	単結合	1	2,6-ビス (エチルチオ) -3-ピリジル
3 1 2	同上	S	S	単結合	2	2,6-ビス (エチルチオ) -3-ピリジル
3 1 3	同上	S	S	単結合	3	2,6-ビス (エチルチオ) -3-ピリジル
3 1 4	同上	S	S	単結合	4	2,6-ビス (エチルチオ) -3-ピリジル
3 1 5	同上	S	S	単結合	5	2,6-ビス (エチルチオ) -3-ピリジル
3 1 6	同上	S	S	単結合	6	2,6-ビス (エチルチオ) -3-ピリジル
3 1 7	同上	S	S	単結合	7	2,6-ビス (エチルチオ) -3-ピリジル
3 1 8	同上	S	S	単結合	8	2,6-ビス (エチルチオ) -3-ピリジル
3 1 9	同上	S	S	単結合	9	2,6-ビス (エチルチオ) -3-ピリジル
3 2 0	同上	S	S	単結合	1 4	2,6-ビス (エチルチオ) -3-ピリジル


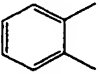
[表 17]

化合物 番号		X	Y	Z	n	H e t
3 2 1		NH	S	単結合	1	2,6-ビス (エチルチオ) -3-ピリジル
3 2 2	同上	NH	S	単結合	2	2,6-ビス (エチルチオ) -3-ピリジル
3 2 3	同上	NH	S	単結合	3	2,6-ビス (エチルチオ) -3-ピリジル
3 2 4	同上	NH	S	単結合	4	2,6-ビス (エチルチオ) -3-ピリジル
3 2 5	同上	NH	S	単結合	5	2,6-ビス (エチルチオ) -3-ピリジル
3 2 6	同上	NH	S	単結合	6	2,6-ビス (エチルチオ) -3-ピリジル
3 2 7	同上	NH	S	単結合	7	2,6-ビス (エチルチオ) -3-ピリジル
3 2 8	同上	NH	S	単結合	8	2,6-ビス (エチルチオ) -3-ピリジル
3 2 9	同上	NH	S	単結合	9	2,6-ビス (エチルチオ) -3-ピリジル
3 3 0	同上	NH	S	単結合	1 4	2,6-ビス (エチルチオ) -3-ピリジル
3 3 1	同上	O	S	単結合	1	2,6-ビス (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
3 3 2	同上	O	S	単結合	2	2,6-ビス (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
3 3 3	同上	O	S	単結合	3	2,6-ビス (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
3 3 4	同上	O	S	単結合	4	2,6-ビス (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
3 3 5	同上	O	S	単結合	5	2,6-ビス (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
3 3 6	同上	O	S	単結合	6	2,6-ビス (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
3 3 7	同上	O	S	単結合	7	2,6-ビス (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
3 3 8	同上	O	S	単結合	8	2,6-ビス (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
3 3 9	同上	O	S	単結合	9	2,6-ビス (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
3 4 0	同上	O	S	単結合	1 4	2,6-ビス (i-プロピルチオ) -3-ピリジル


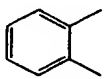
[表 18]

化合物 番号		X	Y	Z	n	Het
341		S	S	単結合	1	2,6-ビス (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
342	同上	S	S	単結合	2	2,6-ビス (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
343	同上	S	S	単結合	3	2,6-ビス (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
344	同上	S	S	単結合	4	2,6-ビス (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
345	同上	S	S	単結合	5	2,6-ビス (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
346	同上	S	S	単結合	6	2,6-ビス (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
347	同上	S	S	単結合	7	2,6-ビス (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
348	同上	S	S	単結合	8	2,6-ビス (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
349	同上	S	S	単結合	9	2,6-ビス (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
350	同上	S	S	単結合	14	2,6-ビス (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
351	同上	NH	S	単結合	1	2,6-ビス (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
352	同上	NH	S	単結合	2	2,6-ビス (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
353	同上	NH	S	単結合	3	2,6-ビス (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
354	同上	NH	S	単結合	4	2,6-ビス (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
355	同上	NH	S	単結合	5	2,6-ビス (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
356	同上	NH	S	単結合	6	2,6-ビス (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
357	同上	NH	S	単結合	7	2,6-ビス (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
358	同上	NH	S	単結合	8	2,6-ビス (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
359	同上	NH	S	単結合	9	2,6-ビス (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
360	同上	NH	S	単結合	14	2,6-ビス (i-プロピルチオ) -3-ピリジル


[表 19]

化合物 番号		X	Y	Z	n	H e t
3 6 1		O	S	単結合	1	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
3 6 2	同上	O	S	単結合	2	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
3 6 3	同上	O	S	単結合	3	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
3 6 4	同上	O	S	単結合	4	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
3 6 5	同上	O	S	単結合	5	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
3 6 6	同上	O	S	単結合	6	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
3 6 7	同上	O	S	単結合	7	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
3 6 8	同上	O	S	単結合	8	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
3 6 9	同上	O	S	単結合	9	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
3 7 0	同上	O	S	単結合	1 4	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
3 7 1	同上	S	S	単結合	1	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
3 7 2	同上	S	S	単結合	2	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
3 7 3	同上	S	S	単結合	3	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
3 7 4	同上	S	S	単結合	4	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
3 7 5	同上	S	S	単結合	5	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
3 7 6	同上	S	S	単結合	6	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
3 7 7	同上	S	S	単結合	7	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
3 7 8	同上	S	S	単結合	8	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
3 7 9	同上	S	S	単結合	9	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
3 8 0	同上	S	S	単結合	1 4	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル

[表 2 0]

化合物 番号		X	Y	Z	n	H e t
3 8 1		NH	S	単結合	1	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
3 8 2	同上	NH	S	単結合	2	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
3 8 3	同上	NH	S	単結合	3	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
3 8 4	同上	NH	S	単結合	4	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
3 8 5	同上	NH	S	単結合	5	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
3 8 6	同上	NH	S	単結合	6	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
3 8 7	同上	NH	S	単結合	7	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
3 8 8	同上	NH	S	単結合	8	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
3 8 9	同上	NH	S	単結合	9	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
3 9 0	同上	NH	S	単結合	1 4	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
3 9 1	同上	O	S	単結合	1	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
3 9 2	同上	O	S	単結合	2	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
3 9 3	同上	O	S	単結合	3	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
3 9 4	同上	O	S	単結合	4	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
3 9 5	同上	O	S	単結合	5	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
3 9 6	同上	O	S	単結合	6	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
3 9 7	同上	O	S	単結合	7	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
3 9 8	同上	O	S	単結合	8	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
3 9 9	同上	O	S	単結合	9	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
4 0 0	同上	O	S	単結合	1 4	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル

[表 2 1]

化合物 番号		X	Y	Z	n	H e t
4 0 1		S	S	単結合	1	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
4 0 2	同上	S	S	単結合	2	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
4 0 3	同上	S	S	単結合	3	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
4 0 4	同上	S	S	単結合	4	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
4 0 5	同上	S	S	単結合	5	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
4 0 6	同上	S	S	単結合	6	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
4 0 7	同上	S	S	単結合	7	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
4 0 8	同上	S	S	単結合	8	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
4 0 9	同上	S	S	単結合	9	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
4 1 0	同上	S	S	単結合	1 4	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
4 1 1	同上	NH	S	単結合	1	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
4 1 2	同上	NH	S	単結合	2	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
4 1 3	同上	NH	S	単結合	3	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
4 1 4	同上	NH	S	単結合	4	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
4 1 5	同上	NH	S	単結合	5	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
4 1 6	同上	NH	S	単結合	6	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
4 1 7	同上	NH	S	単結合	7	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
4 1 8	同上	NH	S	単結合	8	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
4 1 9	同上	NH	S	単結合	9	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
4 2 0	同上	NH	S	単結合	1 4	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル

[表 2 2]

化合物 番号		X	Y	Z	n	H e t
4 2 1		O	S	単結合	1	2- i -プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
4 2 2	同上	O	S	単結合	2	2- i -プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
4 2 3	同上	O	S	単結合	3	2- i -プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
4 2 4	同上	O	S	単結合	4	2- i -プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
4 2 5	同上	O	S	単結合	5	2- i -プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
4 2 6	同上	O	S	単結合	6	2- i -プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
4 2 7	同上	O	S	単結合	7	2- i -プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
4 2 8	同上	O	S	単結合	8	2- i -プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
4 2 9	同上	O	S	単結合	9	2- i -プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
4 3 0	同上	O	S	単結合	1 4	2- i -プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
4 3 1	同上	S	S	単結合	1	2- i -プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
4 3 2	同上	S	S	単結合	2	2- i -プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
4 3 3	同上	S	S	単結合	3	2- i -プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
4 3 4	同上	S	S	単結合	4	2- i -プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
4 3 5	同上	S	S	単結合	5	2- i -プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
4 3 6	同上	S	S	単結合	6	2- i -プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
4 3 7	同上	S	S	単結合	7	2- i -プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
4 3 8	同上	S	S	単結合	8	2- i -プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
4 3 9	同上	S	S	単結合	9	2- i -プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
4 4 0	同上	S	S	単結合	1 4	2- i -プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル

[表 2 3]

化合物 番号		X	Y	Z	n	Het
4 4 1		NH	S	単結合	1	2-i-プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
4 4 2	同上	NH	S	単結合	2	2-i-プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
4 4 3	同上	NH	S	単結合	3	2-i-プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
4 4 4	同上	NH	S	単結合	4	2-i-プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
4 4 5	同上	NH	S	単結合	5	2-i-プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
4 4 6	同上	NH	S	単結合	6	2-i-プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
4 4 7	同上	NH	S	単結合	7	2-i-プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
4 4 8	同上	NH	S	単結合	8	2-i-プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
4 4 9	同上	NH	S	単結合	9	2-i-プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
4 5 0	同上	NH	S	単結合	1 4	2-i-プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
4 5 1	同上	O	S	単結合	1	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
4 5 2	同上	O	S	単結合	2	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
4 5 3	同上	O	S	単結合	3	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
4 5 4	同上	O	S	単結合	4	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
4 5 5	同上	O	S	単結合	5	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
4 5 6	同上	O	S	単結合	6	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
4 5 7	同上	O	S	単結合	7	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
4 5 8	同上	O	S	単結合	8	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
4 5 9	同上	O	S	単結合	9	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
4 6 0	同上	O	S	単結合	1 4	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル

[表 2 4]

化合物 番号		X	Y	Z	n	H e t
4 6 1		S	S	単結合	1	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
4 6 2	同上	S	S	単結合	2	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
4 6 3	同上	S	S	単結合	3	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
4 6 4	同上	S	S	単結合	4	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
4 6 5	同上	S	S	単結合	5	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
4 6 6	同上	S	S	単結合	6	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
4 6 7	同上	S	S	単結合	7	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
4 6 8	同上	S	S	単結合	8	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
4 6 9	同上	S	S	単結合	9	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
4 7 0	同上	S	S	単結合	1 4	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
4 7 1	同上	NH	S	単結合	1	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
4 7 2	同上	NH	S	単結合	2	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
4 7 3	同上	NH	S	単結合	3	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
4 7 4	同上	NH	S	単結合	4	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
4 7 5	同上	NH	S	単結合	5	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
4 7 6	同上	NH	S	単結合	6	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
4 7 7	同上	NH	S	単結合	7	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
4 7 8	同上	NH	S	単結合	8	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
4 7 9	同上	NH	S	単結合	9	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
4 8 0	同上	NH	S	単結合	1 4	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル

[表 2 5]

化合物 番号		X	Y	Z	n	H e t
4 8 1		O	S	単結合	1	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
4 8 2	同上	O	S	単結合	2	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
4 8 3	同上	O	S	単結合	3	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
4 8 4	同上	O	S	単結合	4	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
4 8 5	同上	O	S	単結合	5	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
4 8 6	同上	O	S	単結合	6	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
4 8 7	同上	O	S	単結合	7	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
4 8 8	同上	O	S	単結合	8	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
4 8 9	同上	O	S	単結合	9	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
4 9 0	同上	O	S	単結合	1 4	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
4 9 1	同上	S	S	単結合	1	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
4 9 2	同上	S	S	単結合	2	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
4 9 3	同上	S	S	単結合	3	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
4 9 4	同上	S	S	単結合	4	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
4 9 5	同上	S	S	単結合	5	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
4 9 6	同上	S	S	単結合	6	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
4 9 7	同上	S	S	単結合	7	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
4 9 8	同上	S	S	単結合	8	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
4 9 9	同上	S	S	単結合	9	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
5 0 0	同上	S	S	単結合	1 4	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル

[表 26]

化合物 番号		X	Y	Z	n	H e t
501		NH	S	単結合	1	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
502	同上	NH	S	単結合	2	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
503	同上	NH	S	単結合	3	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
504	同上	NH	S	単結合	4	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
505	同上	NH	S	単結合	5	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
506	同上	NH	S	単結合	6	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
507	同上	NH	S	単結合	7	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
508	同上	NH	S	単結合	8	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
509	同上	NH	S	単結合	9	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
510	同上	NH	S	単結合	14	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
511	同上	O	S	単結合	1	2-i-プロピルチオ-6-メチル-3-ピリジル
512	同上	O	S	単結合	2	2-i-プロピルチオ-6-メチル-3-ピリジル
513	同上	O	S	単結合	3	2-i-プロピルチオ-6-メチル-3-ピリジル
514	同上	O	S	単結合	4	2-i-プロピルチオ-6-メチル-3-ピリジル
515	同上	O	S	単結合	5	2-i-プロピルチオ-6-メチル-3-ピリジル
516	同上	O	S	単結合	6	2-i-プロピルチオ-6-メチル-3-ピリジル
517	同上	O	S	単結合	7	2-i-プロピルチオ-6-メチル-3-ピリジル
518	同上	O	S	単結合	8	2-i-プロピルチオ-6-メチル-3-ピリジル
519	同上	O	S	単結合	9	2-i-プロピルチオ-6-メチル-3-ピリジル
520	同上	O	S	単結合	14	2-i-プロピルチオ-6-メチル-3-ピリジル

[表 2 7]

化合物 番号		X	Y	Z	n	H e t
5 2 1		S	S	単結合	1	2-i-プロピルチオ-6-メチル-3-ピリジル
5 2 2	同上	S	S	単結合	2	2-i-プロピルチオ-6-メチル-3-ピリジル
5 2 3	同上	S	S	単結合	3	2-i-プロピルチオ-6-メチル-3-ピリジル
5 2 4	同上	S	S	単結合	4	2-i-プロピルチオ-6-メチル-3-ピリジル
5 2 5	同上	S	S	単結合	5	2-i-プロピルチオ-6-メチル-3-ピリジル
5 2 6	同上	S	S	単結合	6	2-i-プロピルチオ-6-メチル-3-ピリジル
5 2 7	同上	S	S	単結合	7	2-i-プロピルチオ-6-メチル-3-ピリジル
5 2 8	同上	S	S	単結合	8	2-i-プロピルチオ-6-メチル-3-ピリジル
5 2 9	同上	S	S	単結合	9	2-i-プロピルチオ-6-メチル-3-ピリジル
5 3 0	同上	S	S	単結合	1 4	2-i-プロピルチオ-6-メチル-3-ピリジル
5 3 1	同上	NH	S	単結合	1	2-i-プロピルチオ-6-メチル-3-ピリジル
5 3 2	同上	NH	S	単結合	2	2-i-プロピルチオ-6-メチル-3-ピリジル
5 3 3	同上	NH	S	単結合	3	2-i-プロピルチオ-6-メチル-3-ピリジル
5 3 4	同上	NH	S	単結合	4	2-i-プロピルチオ-6-メチル-3-ピリジル
5 3 5	同上	NH	S	単結合	5	2-i-プロピルチオ-6-メチル-3-ピリジル
5 3 6	同上	NH	S	単結合	6	2-i-プロピルチオ-6-メチル-3-ピリジル
5 3 7	同上	NH	S	単結合	7	2-i-プロピルチオ-6-メチル-3-ピリジル
5 3 8	同上	NH	S	単結合	8	2-i-プロピルチオ-6-メチル-3-ピリジル
5 3 9	同上	NH	S	単結合	9	2-i-プロピルチオ-6-メチル-3-ピリジル
5 4 0	同上	NH	S	単結合	1 4	2-i-プロピルチオ-6-メチル-3-ピリジル



[表 28]

化合物 番号		X	Y	Z	n	Het
5 4 1		O	S	単結合	1	2,6-ジメトキシ-3-ピリジル
5 4 2	同上	O	S	単結合	2	2,6-ジメトキシ-3-ピリジル
5 4 3	同上	O	S	単結合	3	2,6-ジメトキシ-3-ピリジル
5 4 4	同上	O	S	単結合	4	2,6-ジメトキシ-3-ピリジル
5 4 5	同上	O	S	単結合	5	2,6-ジメトキシ-3-ピリジル
5 4 6	同上	O	S	単結合	6	2,6-ジメトキシ-3-ピリジル
5 4 7	同上	O	S	単結合	7	2,6-ジメトキシ-3-ピリジル
5 4 8	同上	O	S	単結合	8	2,6-ジメトキシ-3-ピリジル
5 4 9	同上	O	S	単結合	9	2,6-ジメトキシ-3-ピリジル
5 5 0	同上	O	S	単結合	1 4	2,6-ジメトキシ-3-ピリジル
5 5 1	同上	S	S	単結合	1	2,6-ジメトキシ-3-ピリジル
5 5 2	同上	S	S	単結合	2	2,6-ジメトキシ-3-ピリジル
5 5 3	同上	S	S	単結合	3	2,6-ジメトキシ-3-ピリジル
5 5 4	同上	S	S	単結合	4	2,6-ジメトキシ-3-ピリジル
5 5 5	同上	S	S	単結合	5	2,6-ジメトキシ-3-ピリジル
5 5 6	同上	S	S	単結合	6	2,6-ジメトキシ-3-ピリジル
5 5 7	同上	S	S	単結合	7	2,6-ジメトキシ-3-ピリジル
5 5 8	同上	S	S	単結合	8	2,6-ジメトキシ-3-ピリジル
5 5 9	同上	S	S	単結合	9	2,6-ジメトキシ-3-ピリジル
5 6 0	同上	S	S	単結合	1 4	2,6-ジメトキシ-3-ピリジル


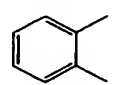
[表 2 9]

化合物 番号		X	Y	Z	n	H e t
5 6 1		NH	S	単結合	1	2, 6-ジメトキシ-3-ピリジル
5 6 2	同上	NH	S	単結合	2	2, 6-ジメトキシ-3-ピリジル
5 6 3	同上	NH	S	単結合	3	2, 6-ジメトキシ-3-ピリジル
5 6 4	同上	NH	S	単結合	4	2, 6-ジメトキシ-3-ピリジル
5 6 5	同上	NH	S	単結合	5	2, 6-ジメトキシ-3-ピリジル
5 6 6	同上	NH	S	単結合	6	2, 6-ジメトキシ-3-ピリジル
5 6 7	同上	NH	S	単結合	7	2, 6-ジメトキシ-3-ピリジル
5 6 8	同上	NH	S	単結合	8	2, 6-ジメトキシ-3-ピリジル
5 6 9	同上	NH	S	単結合	9	2, 6-ジメトキシ-3-ピリジル
5 7 0	同上	NH	S	単結合	1 4	2, 6-ジメトキシ-3-ピリジル
5 7 1	同上	O	S	単結合	1	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
5 7 2	同上	O	S	単結合	2	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
5 7 3	同上	O	S	単結合	3	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
5 7 4	同上	O	S	単結合	4	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
5 7 5	同上	O	S	単結合	5	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
5 7 6	同上	O	S	単結合	6	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
5 7 7	同上	O	S	単結合	7	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
5 7 8	同上	O	S	単結合	8	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
5 7 9	同上	O	S	単結合	9	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
5 8 0	同上	O	S	単結合	1 4	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル



[表 3 0]

化合物 番号		X	Y	Z	n	H e t
5 8 1		S	S	単結合	1	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
5 8 2	同上	S	S	単結合	2	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
5 8 3	同上	S	S	単結合	3	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
5 8 4	同上	S	S	単結合	4	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
5 8 5	同上	S	S	単結合	5	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
5 8 6	同上	S	S	単結合	6	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
5 8 7	同上	S	S	単結合	7	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
5 8 8	同上	S	S	単結合	8	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
5 8 9	同上	S	S	単結合	9	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
5 9 0	同上	S	S	単結合	1 4	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
5 9 1	同上	NH	S	単結合	1	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
5 9 2	同上	NH	S	単結合	2	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
5 9 3	同上	NH	S	単結合	3	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
5 9 4	同上	NH	S	単結合	4	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
5 9 5	同上	NH	S	単結合	5	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
5 9 6	同上	NH	S	単結合	6	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
5 9 7	同上	NH	S	単結合	7	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
5 9 8	同上	NH	S	単結合	8	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
5 9 9	同上	NH	S	単結合	9	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
6 0 0	同上	NH	S	単結合	1 4	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル


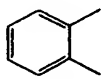
[表 3 1]

化合物 番号		X	Y	Z	n	H e t
6 0 1		O	S	単結合	1	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
6 0 2	同上	O	S	単結合	2	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
6 0 3	同上	O	S	単結合	3	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
6 0 4	同上	O	S	単結合	4	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
6 0 5	同上	O	S	単結合	5	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
6 0 6	同上	O	S	単結合	6	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
6 0 7	同上	O	S	単結合	7	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
6 0 8	同上	O	S	単結合	8	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
6 0 9	同上	O	S	単結合	9	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
6 1 0	同上	O	S	単結合	1 4	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
6 1 1	同上	S	S	単結合	1	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
6 1 2	同上	S	S	単結合	2	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
6 1 3	同上	S	S	単結合	3	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
6 1 4	同上	S	S	単結合	4	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
6 1 5	同上	S	S	単結合	5	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
6 1 6	同上	S	S	単結合	6	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
6 1 7	同上	S	S	単結合	7	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
6 1 8	同上	S	S	単結合	8	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
6 1 9	同上	S	S	単結合	9	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
6 2 0	同上	S	S	単結合	1 4	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル

[表 3 2]

化合物 番号		X	Y	Z	n	H e t
6 2 1		NH	S	単結合	1	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
6 2 2	同上	NH	S	単結合	2	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
6 2 3	同上	NH	S	単結合	3	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
6 2 4	同上	NH	S	単結合	4	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
6 2 5	同上	NH	S	単結合	5	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
6 2 6	同上	NH	S	単結合	6	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
6 2 7	同上	NH	S	単結合	7	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
6 2 8	同上	NH	S	単結合	8	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
6 2 9	同上	NH	S	単結合	9	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
6 3 0	同上	NH	S	単結合	1 4	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
6 3 1	同上	O	S	単結合	1	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
6 3 2	同上	O	S	単結合	2	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
6 3 3	同上	O	S	単結合	3	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
6 3 4	同上	O	S	単結合	4	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
6 3 5	同上	O	S	単結合	5	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
6 3 6	同上	O	S	単結合	6	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
6 3 7	同上	O	S	単結合	7	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
6 3 8	同上	O	S	単結合	8	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
6 3 9	同上	O	S	単結合	9	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
6 4 0	同上	O	S	単結合	1 4	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル


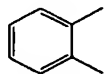
[表 3 3]

化合物 番号		X	Y	Z	n	H e t
6 4 1		S	S	単結合	1	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
6 4 2	同上	S	S	単結合	2	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
6 4 3	同上	S	S	単結合	3	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
6 4 4	同上	S	S	単結合	4	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
6 4 5	同上	S	S	単結合	5	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
6 4 6	同上	S	S	単結合	6	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
6 4 7	同上	S	S	単結合	7	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
6 4 8	同上	S	S	単結合	8	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
6 4 9	同上	S	S	単結合	9	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
6 5 0	同上	S	S	単結合	1 4	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
6 5 1	同上	NH	S	単結合	1	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
6 5 2	同上	NH	S	単結合	2	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
6 5 3	同上	NH	S	単結合	3	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
6 5 4	同上	NH	S	単結合	4	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
6 5 5	同上	NH	S	単結合	5	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
6 5 6	同上	NH	S	単結合	6	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
6 5 7	同上	NH	S	単結合	7	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
6 5 8	同上	NH	S	単結合	8	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
6 5 9	同上	NH	S	単結合	9	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
6 6 0	同上	NH	S	単結合	1 4	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル


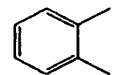
[表 3 4]

化合物 番号		X	Y	Z	n	H e t
6 6 1		O	S	単結合	1	2-メチル-6- i -プロピルチオ-3-ピリジル
6 6 2	同上	O	S	単結合	2	2-メチル-6- i -プロピルチオ-3-ピリジル
6 6 3	同上	O	S	単結合	3	2-メチル-6- i -プロピルチオ-3-ピリジル
6 6 4	同上	O	S	単結合	4	2-メチル-6- i -プロピルチオ-3-ピリジル
6 6 5	同上	O	S	単結合	5	2-メチル-6- i -プロピルチオ-3-ピリジル
6 6 6	同上	O	S	単結合	6	2-メチル-6- i -プロピルチオ-3-ピリジル
6 6 7	同上	O	S	単結合	7	2-メチル-6- i -プロピルチオ-3-ピリジル
6 6 8	同上	O	S	単結合	8	2-メチル-6- i -プロピルチオ-3-ピリジル
6 6 9	同上	O	S	単結合	9	2-メチル-6- i -プロピルチオ-3-ピリジル
6 7 0	同上	O	S	単結合	1 4	2-メチル-6- i -プロピルチオ-3-ピリジル
6 7 1	同上	S	S	単結合	1	2-メチル-6- i -プロピルチオ-3-ピリジル
6 7 2	同上	S	S	単結合	2	2-メチル-6- i -プロピルチオ-3-ピリジル
6 7 3	同上	S	S	単結合	3	2-メチル-6- i -プロピルチオ-3-ピリジル
6 7 4	同上	S	S	単結合	4	2-メチル-6- i -プロピルチオ-3-ピリジル
6 7 5	同上	S	S	単結合	5	2-メチル-6- i -プロピルチオ-3-ピリジル
6 7 6	同上	S	S	単結合	6	2-メチル-6- i -プロピルチオ-3-ピリジル
6 7 7	同上	S	S	単結合	7	2-メチル-6- i -プロピルチオ-3-ピリジル
6 7 8	同上	S	S	単結合	8	2-メチル-6- i -プロピルチオ-3-ピリジル
6 7 9	同上	S	S	単結合	9	2-メチル-6- i -プロピルチオ-3-ピリジル
6 8 0	同上	S	S	単結合	1 4	2-メチル-6- i -プロピルチオ-3-ピリジル

[表 3 5]

化合物 番号		X	Y	Z	n	H e t
6 8 1		NH	S	単結合	1	2-メチル-6- i -プロピルチオ-3-ピリジル
6 8 2	同上	NH	S	単結合	2	2-メチル-6- i -プロピルチオ-3-ピリジル
6 8 3	同上	NH	S	単結合	3	2-メチル-6- i -プロピルチオ-3-ピリジル
6 8 4	同上	NH	S	単結合	4	2-メチル-6- i -プロピルチオ-3-ピリジル
6 8 5	同上	NH	S	単結合	5	2-メチル-6- i -プロピルチオ-3-ピリジル
6 8 6	同上	NH	S	単結合	6	2-メチル-6- i -プロピルチオ-3-ピリジル
6 8 7	同上	NH	S	単結合	7	2-メチル-6- i -プロピルチオ-3-ピリジル
6 8 8	同上	NH	S	単結合	8	2-メチル-6- i -プロピルチオ-3-ピリジル
6 8 9	同上	NH	S	単結合	9	2-メチル-6- i -プロピルチオ-3-ピリジル
6 9 0	同上	NH	S	単結合	1 4	2-メチル-6- i -プロピルチオ-3-ピリジル
6 9 1	同上	O	S	単結合	1	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
6 9 2	同上	O	S	単結合	2	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
6 9 3	同上	O	S	単結合	3	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
6 9 4	同上	O	S	単結合	4	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
6 9 5	同上	O	S	単結合	5	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
6 9 6	同上	O	S	単結合	6	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
6 9 7	同上	O	S	単結合	7	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
6 9 8	同上	O	S	単結合	8	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
6 9 9	同上	O	S	単結合	9	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
7 0 0	同上	O	S	単結合	1 4	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル

[表 3 6]

化合物 番号		X	Y	Z	n	H e t
7 0 1		S	S	単結合	1	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
7 0 2	同上	S	S	単結合	2	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
7 0 3	同上	S	S	単結合	3	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
7 0 4	同上	S	S	単結合	4	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
7 0 5	同上	S	S	単結合	5	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
7 0 6	同上	S	S	単結合	6	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
7 0 7	同上	S	S	単結合	7	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
7 0 8	同上	S	S	単結合	8	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
7 0 9	同上	S	S	単結合	9	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
7 1 0	同上	S	S	単結合	1 4	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
7 1 1	同上	NH	S	単結合	1	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
7 1 2	同上	NH	S	単結合	2	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
7 1 3	同上	NH	S	単結合	3	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
7 1 4	同上	NH	S	単結合	4	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
7 1 5	同上	NH	S	単結合	5	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
7 1 6	同上	NH	S	単結合	6	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
7 1 7	同上	NH	S	単結合	7	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
7 1 8	同上	NH	S	単結合	8	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
7 1 9	同上	NH	S	単結合	9	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
7 2 0	同上	NH	S	単結合	1 4	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル

[表 3 7]

化合物 番号		X	Y	Z	n	H e t
7 2 1		O	S	単結合	1	2,6-ジメチル-3-ピリジル
7 2 2	同上	O	S	単結合	2	2,6-ジメチル-3-ピリジル
7 2 3	同上	O	S	単結合	3	2,6-ジメチル-3-ピリジル
7 2 4	同上	O	S	単結合	4	2,6-ジメチル-3-ピリジル
7 2 5	同上	O	S	単結合	5	2,6-ジメチル-3-ピリジル
7 2 6	同上	O	S	単結合	6	2,6-ジメチル-3-ピリジル
7 2 7	同上	O	S	単結合	7	2,6-ジメチル-3-ピリジル
7 2 8	同上	O	S	単結合	8	2,6-ジメチル-3-ピリジル
7 2 9	同上	O	S	単結合	9	2,6-ジメチル-3-ピリジル
7 3 0	同上	O	S	単結合	1 4	2,6-ジメチル-3-ピリジル
7 3 1	同上	S	S	単結合	1	2,6-ジメチル-3-ピリジル
7 3 2	同上	S	S	単結合	2	2,6-ジメチル-3-ピリジル
7 3 3	同上	S	S	単結合	3	2,6-ジメチル-3-ピリジル
7 3 4	同上	S	S	単結合	4	2,6-ジメチル-3-ピリジル
7 3 5	同上	S	S	単結合	5	2,6-ジメチル-3-ピリジル
7 3 6	同上	S	S	単結合	6	2,6-ジメチル-3-ピリジル
7 3 7	同上	S	S	単結合	7	2,6-ジメチル-3-ピリジル
7 3 8	同上	S	S	単結合	8	2,6-ジメチル-3-ピリジル
7 3 9	同上	S	S	単結合	9	2,6-ジメチル-3-ピリジル
7 4 0	同上	S	S	単結合	1 4	2,6-ジメチル-3-ピリジル

[表 38]

化合物 番号		X	Y	Z	n	H e t
7 4 1		NH	S	単結合	1	2,6-ジメチル-3-ピリジル
7 4 2	同上	NH	S	単結合	2	2,6-ジメチル-3-ピリジル
7 4 3	同上	NH	S	単結合	3	2,6-ジメチル-3-ピリジル
7 4 4	同上	NH	S	単結合	4	2,6-ジメチル-3-ピリジル
7 4 5	同上	NH	S	単結合	5	2,6-ジメチル-3-ピリジル
7 4 6	同上	NH	S	単結合	6	2,6-ジメチル-3-ピリジル
7 4 7	同上	NH	S	単結合	7	2,6-ジメチル-3-ピリジル
7 4 8	同上	NH	S	単結合	8	2,6-ジメチル-3-ピリジル
7 4 9	同上	NH	S	単結合	9	2,6-ジメチル-3-ピリジル
7 5 0	同上	NH	S	単結合	1 4	2,6-ジメチル-3-ピリジル
7 5 1	同上	O	S	単結合	1	2,6-ジエチル-3-ピリジル
7 5 2	同上	O	S	単結合	2	2,6-ジエチル-3-ピリジル
7 5 3	同上	O	S	単結合	3	2,6-ジエチル-3-ピリジル
7 5 4	同上	O	S	単結合	4	2,6-ジエチル-3-ピリジル
7 5 5	同上	O	S	単結合	5	2,6-ジエチル-3-ピリジル
7 5 6	同上	O	S	単結合	6	2,6-ジエチル-3-ピリジル
7 5 7	同上	O	S	単結合	7	2,6-ジエチル-3-ピリジル
7 5 8	同上	O	S	単結合	8	2,6-ジエチル-3-ピリジル
7 5 9	同上	O	S	単結合	9	2,6-ジエチル-3-ピリジル
7 6 0	同上	O	S	単結合	1 4	2,6-ジエチル-3-ピリジル

[表 3 9]

化合物 番号		X	Y	Z	n	H e t
7 6 1		S	S	単結合	1	2, 6-ジエチル-3-ピリジル
7 6 2	同上	S	S	単結合	2	2, 6-ジエチル-3-ピリジル
7 6 3	同上	S	S	単結合	3	2, 6-ジエチル-3-ピリジル
7 6 4	同上	S	S	単結合	4	2, 6-ジエチル-3-ピリジル
7 6 5	同上	S	S	単結合	5	2, 6-ジエチル-3-ピリジル
7 6 6	同上	S	S	単結合	6	2, 6-ジエチル-3-ピリジル
7 6 7	同上	S	S	単結合	7	2, 6-ジエチル-3-ピリジル
7 6 8	同上	S	S	単結合	8	2, 6-ジエチル-3-ピリジル
7 6 9	同上	S	S	単結合	9	2, 6-ジエチル-3-ピリジル
7 7 0	同上	S	S	単結合	1 4	2, 6-ジエチル-3-ピリジル
7 7 1	同上	NH	S	単結合	1	2, 6-ジエチル-3-ピリジル
7 7 2	同上	NH	S	単結合	2	2, 6-ジエチル-3-ピリジル
7 7 3	同上	NH	S	単結合	3	2, 6-ジエチル-3-ピリジル
7 7 4	同上	NH	S	単結合	4	2, 6-ジエチル-3-ピリジル
7 7 5	同上	NH	S	単結合	5	2, 6-ジエチル-3-ピリジル
7 7 6	同上	NH	S	単結合	6	2, 6-ジエチル-3-ピリジル
7 7 7	同上	NH	S	単結合	7	2, 6-ジエチル-3-ピリジル
7 7 8	同上	NH	S	単結合	8	2, 6-ジエチル-3-ピリジル
7 7 9	同上	NH	S	単結合	9	2, 6-ジエチル-3-ピリジル
7 8 0	同上	NH	S	単結合	1 4	2, 6-ジエチル-3-ピリジル

[表 40]

化合物 番号		X	Y	Z	n	Het
781		O	S	単結合	1	2,4-ビス (メチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
782	同上	O	S	単結合	2	2,4-ビス (メチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
783	同上	O	S	単結合	3	2,4-ビス (メチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
784	同上	O	S	単結合	4	2,4-ビス (メチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
785	同上	O	S	単結合	5	2,4-ビス (メチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
786	同上	O	S	単結合	6	2,4-ビス (メチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
787	同上	O	S	単結合	7	2,4-ビス (メチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
788	同上	O	S	単結合	8	2,4-ビス (メチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
789	同上	O	S	単結合	9	2,4-ビス (メチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
790	同上	O	S	単結合	14	2,4-ビス (メチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
791	同上	S	S	単結合	1	2,4-ビス (メチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
792	同上	S	S	単結合	2	2,4-ビス (メチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
793	同上	S	S	単結合	3	2,4-ビス (メチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
794	同上	S	S	単結合	4	2,4-ビス (メチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
795	同上	S	S	単結合	5	2,4-ビス (メチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
796	同上	S	S	単結合	6	2,4-ビス (メチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
797	同上	S	S	単結合	7	2,4-ビス (メチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
798	同上	S	S	単結合	8	2,4-ビス (メチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
799	同上	S	S	単結合	9	2,4-ビス (メチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
800	同上	S	S	単結合	14	2,4-ビス (メチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル


[表 4 1]

化合物 番号		X	Y	Z	n	H e t
8 0 1		NH	S	単結合	1	2,4-ビス (メチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 0 2	同上	NH	S	単結合	2	2,4-ビス (メチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 0 3	同上	NH	S	単結合	3	2,4-ビス (メチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 0 4	同上	NH	S	単結合	4	2,4-ビス (メチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 0 5	同上	NH	S	単結合	5	2,4-ビス (メチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 0 6	同上	NH	S	単結合	6	2,4-ビス (メチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 0 7	同上	NH	S	単結合	7	2,4-ビス (メチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 0 8	同上	NH	S	単結合	8	2,4-ビス (メチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 0 9	同上	NH	S	単結合	9	2,4-ビス (メチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 1 0	同上	NH	S	単結合	1 4	2,4-ビス (メチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 1 1	同上	O	S	単結合	1	2,4-ビス (エチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 1 2	同上	O	S	単結合	2	2,4-ビス (エチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 1 3	同上	O	S	単結合	3	2,4-ビス (エチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 1 4	同上	O	S	単結合	4	2,4-ビス (エチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 1 5	同上	O	S	単結合	5	2,4-ビス (エチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 1 6	同上	O	S	単結合	6	2,4-ビス (エチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 1 7	同上	O	S	単結合	7	2,4-ビス (エチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 1 8	同上	O	S	単結合	8	2,4-ビス (エチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 1 9	同上	O	S	単結合	9	2,4-ビス (エチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 2 0	同上	O	S	単結合	1 4	2,4-ビス (エチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル

[表 4 2]

化合物 番号		X	Y	Z	n	H e t
8 2 1		S	S	単結合	1	2, 4-ビス (エチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 2 2	同上	S	S	単結合	2	2, 4-ビス (エチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 2 3	同上	S	S	単結合	3	2, 4-ビス (エチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 2 4	同上	S	S	単結合	4	2, 4-ビス (エチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 2 5	同上	S	S	単結合	5	2, 4-ビス (エチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 2 6	同上	S	S	単結合	6	2, 4-ビス (エチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 2 7	同上	S	S	単結合	7	2, 4-ビス (エチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 2 8	同上	S	S	単結合	8	2, 4-ビス (エチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 2 9	同上	S	S	単結合	9	2, 4-ビス (エチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 3 0	同上	S	S	単結合	1 4	2, 4-ビス (エチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 3 1	同上	NH	S	単結合	1	2, 4-ビス (エチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 3 2	同上	NH	S	単結合	2	2, 4-ビス (エチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 3 3	同上	NH	S	単結合	3	2, 4-ビス (エチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 3 4	同上	NH	S	単結合	4	2, 4-ビス (エチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 3 5	同上	NH	S	単結合	5	2, 4-ビス (エチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 3 6	同上	NH	S	単結合	6	2, 4-ビス (エチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 3 7	同上	NH	S	単結合	7	2, 4-ビス (エチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 3 8	同上	NH	S	単結合	8	2, 4-ビス (エチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 3 9	同上	NH	S	単結合	9	2, 4-ビス (エチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 4 0	同上	NH	S	単結合	1 4	2, 4-ビス (エチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル


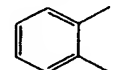
[表 4 3]

化合物 番号		X	Y	Z	n	H e t
8 4 1		O	S	単結合	1	2,4-ビス (i-プロピルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 4 2	同上	O	S	単結合	2	2,4-ビス (i-プロピルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 4 3	同上	O	S	単結合	3	2,4-ビス (i-プロピルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 4 4	同上	O	S	単結合	4	2,4-ビス (i-プロピルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 4 5	同上	O	S	単結合	5	2,4-ビス (i-プロピルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 4 6	同上	O	S	単結合	6	2,4-ビス (i-プロピルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 4 7	同上	O	S	単結合	7	2,4-ビス (i-プロピルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 4 8	同上	O	S	単結合	8	2,4-ビス (i-プロピルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 4 9	同上	O	S	単結合	9	2,4-ビス (i-プロピルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 5 0	同上	O	S	単結合	1 4	2,4-ビス (i-プロピルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 5 1	同上	S	S	単結合	1	2,4-ビス (i-プロピルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 5 2	同上	S	S	単結合	2	2,4-ビス (i-プロピルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 5 3	同上	S	S	単結合	3	2,4-ビス (i-プロピルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 5 4	同上	S	S	単結合	4	2,4-ビス (i-プロピルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 5 5	同上	S	S	単結合	5	2,4-ビス (i-プロピルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 5 6	同上	S	S	単結合	6	2,4-ビス (i-プロピルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 5 7	同上	S	S	単結合	7	2,4-ビス (i-プロピルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 5 8	同上	S	S	単結合	8	2,4-ビス (i-プロピルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 5 9	同上	S	S	単結合	9	2,4-ビス (i-プロピルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 6 0	同上	S	S	単結合	1 4	2,4-ビス (i-プロピルチオ) -6-メチル-3-ピリジル


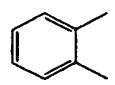
[表 4 4]

化合物 番号		X	Y	Z	n	H e t
8 6 1		NH	S	単結合	1	2, 4-ビス (i-プロピルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 6 2	同上	NH	S	単結合	2	2, 4-ビス (i-プロピルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 6 3	同上	NH	S	単結合	3	2, 4-ビス (i-プロピルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 6 4	同上	NH	S	単結合	4	2, 4-ビス (i-プロピルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 6 5	同上	NH	S	単結合	5	2, 4-ビス (i-プロピルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 6 6	同上	NH	S	単結合	6	2, 4-ビス (i-プロピルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 6 7	同上	NH	S	単結合	7	2, 4-ビス (i-プロピルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 6 8	同上	NH	S	単結合	8	2, 4-ビス (i-プロピルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 6 9	同上	NH	S	単結合	9	2, 4-ビス (i-プロピルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 7 0	同上	NH	S	単結合	1 4	2, 4-ビス (i-プロピルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
8 7 1	同上	O	S	単結合	1	2, 4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
8 7 2	同上	O	S	単結合	2	2, 4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
8 7 3	同上	O	S	単結合	3	2, 4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
8 7 4	同上	O	S	単結合	4	2, 4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
8 7 5	同上	O	S	単結合	5	2, 4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
8 7 6	同上	O	S	単結合	6	2, 4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
8 7 7	同上	O	S	単結合	7	2, 4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
8 7 8	同上	O	S	単結合	8	2, 4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
8 7 9	同上	O	S	単結合	9	2, 4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
8 8 0	同上	O	S	単結合	1 4	2, 4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル


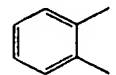
[表 4 5]

化合物 番号		X	Y	Z	n	Het
881		S	S	単結合	1	2,4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
882	同上	S	S	単結合	2	2,4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
883	同上	S	S	単結合	3	2,4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
884	同上	S	S	単結合	4	2,4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
885	同上	S	S	単結合	5	2,4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
886	同上	S	S	単結合	6	2,4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
887	同上	S	S	単結合	7	2,4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
888	同上	S	S	単結合	8	2,4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
889	同上	S	S	単結合	9	2,4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
890	同上	S	S	単結合	14	2,4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
891	同上	NH	S	単結合	1	2,4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
892	同上	NH	S	単結合	2	2,4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
893	同上	NH	S	単結合	3	2,4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
894	同上	NH	S	単結合	4	2,4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
895	同上	NH	S	単結合	5	2,4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
896	同上	NH	S	単結合	6	2,4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
897	同上	NH	S	単結合	7	2,4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
898	同上	NH	S	単結合	8	2,4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
899	同上	NH	S	単結合	9	2,4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
900	同上	NH	S	単結合	14	2,4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル

[表 4 6]

化合物 番号		X	Y	Z	n	H e t
9 0 1		O	S	単結合	1	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
9 0 2	同上	O	S	単結合	2	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
9 0 3	同上	O	S	単結合	3	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
9 0 4	同上	O	S	単結合	4	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
9 0 5	同上	O	S	単結合	5	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
9 0 6	同上	O	S	単結合	6	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
9 0 7	同上	O	S	単結合	7	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
9 0 8	同上	O	S	単結合	8	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
9 0 9	同上	O	S	単結合	9	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
9 1 0	同上	O	S	単結合	1 4	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
9 1 1	同上	S	S	単結合	1	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
9 1 2	同上	S	S	単結合	2	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
9 1 3	同上	S	S	単結合	3	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
9 1 4	同上	S	S	単結合	4	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
9 1 5	同上	S	S	単結合	5	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
9 1 6	同上	S	S	単結合	6	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
9 1 7	同上	S	S	単結合	7	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
9 1 8	同上	S	S	単結合	8	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
9 1 9	同上	S	S	単結合	9	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
9 2 0	同上	S	S	単結合	1 4	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル


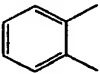
[表 4 7]

化合物 番号		X	Y	Z	n	H e t
9 2 1		NH	S	単結合	1	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
9 2 2	同上	NH	S	単結合	2	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
9 2 3	同上	NH	S	単結合	3	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
9 2 4	同上	NH	S	単結合	4	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
9 2 5	同上	NH	S	単結合	5	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
9 2 6	同上	NH	S	単結合	6	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
9 2 7	同上	NH	S	単結合	7	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
9 2 8	同上	NH	S	単結合	8	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
9 2 9	同上	NH	S	単結合	9	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
9 3 0	同上	NH	S	単結合	1 4	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
9 3 1	同上	O	S	単結合	1	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
9 3 2	同上	O	S	単結合	2	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
9 3 3	同上	O	S	単結合	3	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
9 3 4	同上	O	S	単結合	4	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
9 3 5	同上	O	S	単結合	5	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
9 3 6	同上	O	S	単結合	6	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
9 3 7	同上	O	S	単結合	7	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
9 3 8	同上	O	S	単結合	8	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
9 3 9	同上	O	S	単結合	9	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
9 4 0	同上	O	S	単結合	1 4	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル


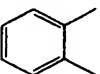
[表 4 8]

化合物 番号		X	Y	Z	n	H e t
9 4 1		S	S	単結合	1	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
9 4 2	同上	S	S	単結合	2	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
9 4 3	同上	S	S	単結合	3	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
9 4 4	同上	S	S	単結合	4	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
9 4 5	同上	S	S	単結合	5	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
9 4 6	同上	S	S	単結合	6	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
9 4 7	同上	S	S	単結合	7	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
9 4 8	同上	S	S	単結合	8	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
9 4 9	同上	S	S	単結合	9	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
9 5 0	同上	S	S	単結合	1 4	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
9 5 1	同上	NH	S	単結合	1	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
9 5 2	同上	NH	S	単結合	2	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
9 5 3	同上	NH	S	単結合	3	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
9 5 4	同上	NH	S	単結合	4	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
9 5 5	同上	NH	S	単結合	5	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
9 5 6	同上	NH	S	単結合	6	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
9 5 7	同上	NH	S	単結合	7	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
9 5 8	同上	NH	S	単結合	8	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
9 5 9	同上	NH	S	単結合	9	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
9 6 0	同上	NH	S	単結合	1 4	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル


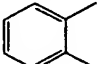
[表 4 9]

化合物 番号		X	Y	Z	n	H e t
9 6 1		O	S	単結合	1	2, 4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
9 6 2	同上	O	S	単結合	2	2, 4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
9 6 3	同上	O	S	単結合	3	2, 4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
9 6 4	同上	O	S	単結合	4	2, 4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
9 6 5	同上	O	S	単結合	5	2, 4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
9 6 6	同上	O	S	単結合	6	2, 4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
9 6 7	同上	O	S	単結合	7	2, 4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
9 6 8	同上	O	S	単結合	8	2, 4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
9 6 9	同上	O	S	単結合	9	2, 4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
9 7 0	同上	O	S	単結合	1 4	2, 4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
9 7 1	同上	S	S	単結合	1	2, 4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
9 7 2	同上	S	S	単結合	2	2, 4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
9 7 3	同上	S	S	単結合	3	2, 4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
9 7 4	同上	S	S	単結合	4	2, 4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
9 7 5	同上	S	S	単結合	5	2, 4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
9 7 6	同上	S	S	単結合	6	2, 4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
9 7 7	同上	S	S	単結合	7	2, 4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
9 7 8	同上	S	S	単結合	8	2, 4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
9 7 9	同上	S	S	単結合	9	2, 4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
9 8 0	同上	S	S	単結合	1 4	2, 4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル


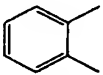
[表 50]

化合物番号		X	Y	Z	n	Het
981		NH	S	単結合	1	2,4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
982	同上	NH	S	単結合	2	2,4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
983	同上	NH	S	単結合	3	2,4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
984	同上	NH	S	単結合	4	2,4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
985	同上	NH	S	単結合	5	2,4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
986	同上	NH	S	単結合	6	2,4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
987	同上	NH	S	単結合	7	2,4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
988	同上	NH	S	単結合	8	2,4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
989	同上	NH	S	単結合	9	2,4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
990	同上	NH	S	単結合	14	2,4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
991	同上	O	S	単結合	1	4,6-ビス(メチルチオ)-5-ピリミジル
992	同上	O	S	単結合	2	4,6-ビス(メチルチオ)-5-ピリミジル
993	同上	O	S	単結合	3	4,6-ビス(メチルチオ)-5-ピリミジル
994	同上	O	S	単結合	4	4,6-ビス(メチルチオ)-5-ピリミジル
995	同上	O	S	単結合	5	4,6-ビス(メチルチオ)-5-ピリミジル
996	同上	O	S	単結合	6	4,6-ビス(メチルチオ)-5-ピリミジル
997	同上	O	S	単結合	7	4,6-ビス(メチルチオ)-5-ピリミジル
998	同上	O	S	単結合	8	4,6-ビス(メチルチオ)-5-ピリミジル
999	同上	O	S	単結合	9	4,6-ビス(メチルチオ)-5-ピリミジル
1000	同上	O	S	単結合	14	4,6-ビス(メチルチオ)-5-ピリミジル


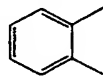
[表 5 1]

化合物番号		X	Y	Z	n	H e t
1 0 0 1		S	S	単結合	1	4, 6-ビス (メチルチオ) -5-ピリミジル
1 0 0 2	同上	S	S	単結合	2	4, 6-ビス (メチルチオ) -5-ピリミジル
1 0 0 3	同上	S	S	単結合	3	4, 6-ビス (メチルチオ) -5-ピリミジル
1 0 0 4	同上	S	S	単結合	4	4, 6-ビス (メチルチオ) -5-ピリミジル
1 0 0 5	同上	S	S	単結合	5	4, 6-ビス (メチルチオ) -5-ピリミジル
1 0 0 6	同上	S	S	単結合	6	4, 6-ビス (メチルチオ) -5-ピリミジル
1 0 0 7	同上	S	S	単結合	7	4, 6-ビス (メチルチオ) -5-ピリミジル
1 0 0 8	同上	S	S	単結合	8	4, 6-ビス (メチルチオ) -5-ピリミジル
1 0 0 9	同上	S	S	単結合	9	4, 6-ビス (メチルチオ) -5-ピリミジル
1 0 1 0	同上	S	S	単結合	1 4	4, 6-ビス (メチルチオ) -5-ピリミジル
1 0 1 1	同上	NH	S	単結合	1	4, 6-ビス (メチルチオ) -5-ピリミジル
1 0 1 2	同上	NH	S	単結合	2	4, 6-ビス (メチルチオ) -5-ピリミジル
1 0 1 3	同上	NH	S	単結合	3	4, 6-ビス (メチルチオ) -5-ピリミジル
1 0 1 4	同上	NH	S	単結合	4	4, 6-ビス (メチルチオ) -5-ピリミジル
1 0 1 5	同上	NH	S	単結合	5	4, 6-ビス (メチルチオ) -5-ピリミジル
1 0 1 6	同上	NH	S	単結合	6	4, 6-ビス (メチルチオ) -5-ピリミジル
1 0 1 7	同上	NH	S	単結合	7	4, 6-ビス (メチルチオ) -5-ピリミジル
1 0 1 8	同上	NH	S	単結合	8	4, 6-ビス (メチルチオ) -5-ピリミジル
1 0 1 9	同上	NH	S	単結合	9	4, 6-ビス (メチルチオ) -5-ピリミジル
1 0 2 0	同上	NH	S	単結合	1 4	4, 6-ビス (メチルチオ) -5-ピリミジル

[表 5 2]

化合物番号		X	Y	Z	n	H e t
1 0 2 1		O	S	単結合	1	4, 6-ビス (エチルチオ) -5-ピリミジル
1 0 2 2	同上	O	S	単結合	2	4, 6-ビス (エチルチオ) -5-ピリミジル
1 0 2 3	同上	O	S	単結合	3	4, 6-ビス (エチルチオ) -5-ピリミジル
1 0 2 4	同上	O	S	単結合	4	4, 6-ビス (エチルチオ) -5-ピリミジル
1 0 2 5	同上	O	S	単結合	5	4, 6-ビス (エチルチオ) -5-ピリミジル
1 0 2 6	同上	O	S	単結合	6	4, 6-ビス (エチルチオ) -5-ピリミジル
1 0 2 7	同上	O	S	単結合	7	4, 6-ビス (エチルチオ) -5-ピリミジル
1 0 2 8	同上	O	S	単結合	8	4, 6-ビス (エチルチオ) -5-ピリミジル
1 0 2 9	同上	O	S	単結合	9	4, 6-ビス (エチルチオ) -5-ピリミジル
1 0 3 0	同上	O	S	単結合	1 4	4, 6-ビス (エチルチオ) -5-ピリミジル
1 0 3 1	同上	S	S	単結合	1	4, 6-ビス (エチルチオ) -5-ピリミジル
1 0 3 2	同上	S	S	単結合	2	4, 6-ビス (エチルチオ) -5-ピリミジル
1 0 3 3	同上	S	S	単結合	3	4, 6-ビス (エチルチオ) -5-ピリミジル
1 0 3 4	同上	S	S	単結合	4	4, 6-ビス (エチルチオ) -5-ピリミジル
1 0 3 5	同上	S	S	単結合	5	4, 6-ビス (エチルチオ) -5-ピリミジル
1 0 3 6	同上	S	S	単結合	6	4, 6-ビス (エチルチオ) -5-ピリミジル
1 0 3 7	同上	S	S	単結合	7	4, 6-ビス (エチルチオ) -5-ピリミジル
1 0 3 8	同上	S	S	単結合	8	4, 6-ビス (エチルチオ) -5-ピリミジル
1 0 3 9	同上	S	S	単結合	9	4, 6-ビス (エチルチオ) -5-ピリミジル
1 0 4 0	同上	S	S	単結合	1 4	4, 6-ビス (エチルチオ) -5-ピリミジル


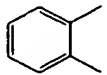
[表 5 3]

化合物番号		X	Y	Z	n	H e t
1 0 4 1		NH	S	単結合	1	4, 6-ビス (エチルチオ) -5-ピリミジル
1 0 4 2	同上	NH	S	単結合	2	4, 6-ビス (エチルチオ) -5-ピリミジル
1 0 4 3	同上	NH	S	単結合	3	4, 6-ビス (エチルチオ) -5-ピリミジル
1 0 4 4	同上	NH	S	単結合	4	4, 6-ビス (エチルチオ) -5-ピリミジル
1 0 4 5	同上	NH	S	単結合	5	4, 6-ビス (エチルチオ) -5-ピリミジル
1 0 4 6	同上	NH	S	単結合	6	4, 6-ビス (エチルチオ) -5-ピリミジル
1 0 4 7	同上	NH	S	単結合	7	4, 6-ビス (エチルチオ) -5-ピリミジル
1 0 4 8	同上	NH	S	単結合	8	4, 6-ビス (エチルチオ) -5-ピリミジル
1 0 4 9	同上	NH	S	単結合	9	4, 6-ビス (エチルチオ) -5-ピリミジル
1 0 5 0	同上	NH	S	単結合	1 4	4, 6-ビス (エチルチオ) -5-ピリミジル
1 0 5 1	同上	O	S	単結合	1	4, 6-ビス (i-プロピルチオ) -5-ピリミジル
1 0 5 2	同上	O	S	単結合	2	4, 6-ビス (i-プロピルチオ) -5-ピリミジル
1 0 5 3	同上	O	S	単結合	3	4, 6-ビス (i-プロピルチオ) -5-ピリミジル
1 0 5 4	同上	O	S	単結合	4	4, 6-ビス (i-プロピルチオ) -5-ピリミジル
1 0 5 5	同上	O	S	単結合	5	4, 6-ビス (i-プロピルチオ) -5-ピリミジル
1 0 5 6	同上	O	S	単結合	6	4, 6-ビス (i-プロピルチオ) -5-ピリミジル
1 0 5 7	同上	O	S	単結合	7	4, 6-ビス (i-プロピルチオ) -5-ピリミジル
1 0 5 8	同上	O	S	単結合	8	4, 6-ビス (i-プロピルチオ) -5-ピリミジル
1 0 5 9	同上	O	S	単結合	9	4, 6-ビス (i-プロピルチオ) -5-ピリミジル
1 0 6 0	同上	O	S	単結合	1 4	4, 6-ビス (i-プロピルチオ) -5-ピリミジル

[表 5 4]

化合物番号		X	Y	Z	n	Het
1061		S	S	単結合	1	4,6-ビス (i-プロピルチオ) -5-ピリミジル
1062	同上	S	S	単結合	2	4,6-ビス (i-プロピルチオ) -5-ピリミジル
1063	同上	S	S	単結合	3	4,6-ビス (i-プロピルチオ) -5-ピリミジル
1064	同上	S	S	単結合	4	4,6-ビス (i-プロピルチオ) -5-ピリミジル
1065	同上	S	S	単結合	5	4,6-ビス (i-プロピルチオ) -5-ピリミジル
1066	同上	S	S	単結合	6	4,6-ビス (i-プロピルチオ) -5-ピリミジル
1067	同上	S	S	単結合	7	4,6-ビス (i-プロピルチオ) -5-ピリミジル
1068	同上	S	S	単結合	8	4,6-ビス (i-プロピルチオ) -5-ピリミジル
1069	同上	S	S	単結合	9	4,6-ビス (i-プロピルチオ) -5-ピリミジル
1070	同上	S	S	単結合	14	4,6-ビス (i-プロピルチオ) -5-ピリミジル
1071	同上	NH	S	単結合	1	4,6-ビス (i-プロピルチオ) -5-ピリミジル
1072	同上	NH	S	単結合	2	4,6-ビス (i-プロピルチオ) -5-ピリミジル
1073	同上	NH	S	単結合	3	4,6-ビス (i-プロピルチオ) -5-ピリミジル
1074	同上	NH	S	単結合	4	4,6-ビス (i-プロピルチオ) -5-ピリミジル
1075	同上	NH	S	単結合	5	4,6-ビス (i-プロピルチオ) -5-ピリミジル
1076	同上	NH	S	単結合	6	4,6-ビス (i-プロピルチオ) -5-ピリミジル
1077	同上	NH	S	単結合	7	4,6-ビス (i-プロピルチオ) -5-ピリミジル
1078	同上	NH	S	単結合	8	4,6-ビス (i-プロピルチオ) -5-ピリミジル
1079	同上	NH	S	単結合	9	4,6-ビス (i-プロピルチオ) -5-ピリミジル
1080	同上	NH	S	単結合	14	4,6-ビス (i-プロピルチオ) -5-ピリミジル

[表 5 5]

化合物番号		X	Y	Z	n	Het
1081		O	S	単結合	1	4,6-ジメトキシ-5-ピリミジル
1082	同上	O	S	単結合	2	4,6-ジメトキシ-5-ピリミジル
1083	同上	O	S	単結合	3	4,6-ジメトキシ-5-ピリミジル
1084	同上	O	S	単結合	4	4,6-ジメトキシ-5-ピリミジル
1085	同上	O	S	単結合	5	4,6-ジメトキシ-5-ピリミジル
1086	同上	O	S	単結合	6	4,6-ジメトキシ-5-ピリミジル
1087	同上	O	S	単結合	7	4,6-ジメトキシ-5-ピリミジル
1088	同上	O	S	単結合	8	4,6-ジメトキシ-5-ピリミジル
1089	同上	O	S	単結合	9	4,6-ジメトキシ-5-ピリミジル
1090	同上	O	S	単結合	14	4,6-ジメトキシ-5-ピリミジル
1091	同上	S	S	単結合	1	4,6-ジメトキシ-5-ピリミジル
1092	同上	S	S	単結合	2	4,6-ジメトキシ-5-ピリミジル
1093	同上	S	S	単結合	3	4,6-ジメトキシ-5-ピリミジル
1094	同上	S	S	単結合	4	4,6-ジメトキシ-5-ピリミジル
1095	同上	S	S	単結合	5	4,6-ジメトキシ-5-ピリミジル
1096	同上	S	S	単結合	6	4,6-ジメトキシ-5-ピリミジル
1097	同上	S	S	単結合	7	4,6-ジメトキシ-5-ピリミジル
1098	同上	S	S	単結合	8	4,6-ジメトキシ-5-ピリミジル
1099	同上	S	S	単結合	9	4,6-ジメトキシ-5-ピリミジル
1100	同上	S	S	単結合	14	4,6-ジメトキシ-5-ピリミジル

[表 5 6]

化合物番号		X	Y	Z	n	H e t
1 1 0 1		NH	S	単結合	1	4, 6-ジクロロ-2-メチル-5-ピリミジル
1 1 0 2	同上	NH	S	単結合	2	4, 6-ジクロロ-2-メチル-5-ピリミジル
1 1 0 3	同上	NH	S	単結合	3	4, 6-ジクロロ-2-メチル-5-ピリミジル
1 1 0 4	同上	NH	S	単結合	4	4, 6-ジクロロ-2-メチル-5-ピリミジル
1 1 0 5	同上	NH	S	単結合	5	4, 6-ジクロロ-2-メチル-5-ピリミジル
1 1 0 6	同上	NH	S	単結合	6	4, 6-ジクロロ-2-メチル-5-ピリミジル
1 1 0 7	同上	NH	S	単結合	7	4, 6-ジクロロ-2-メチル-5-ピリミジル
1 1 0 8	同上	NH	S	単結合	8	4, 6-ジクロロ-2-メチル-5-ピリミジル
1 1 0 9	同上	NH	S	単結合	9	4, 6-ジクロロ-2-メチル-5-ピリミジル
1 1 1 0	同上	NH	S	単結合	1 4	4, 6-ジクロロ-2-メチル-5-ピリミジル
1 1 1 1	同上	O	S	単結合	1	4, 6-ビス (ジメチルアミノ) -5-ピリミジル
1 1 1 2	同上	O	S	単結合	2	4, 6-ビス (ジメチルアミノ) -5-ピリミジル
1 1 1 3	同上	O	S	単結合	3	4, 6-ビス (ジメチルアミノ) -5-ピリミジル
1 1 1 4	同上	O	S	単結合	4	4, 6-ビス (ジメチルアミノ) -5-ピリミジル
1 1 1 5	同上	O	S	単結合	5	4, 6-ビス (ジメチルアミノ) -5-ピリミジル
1 1 1 6	同上	O	S	単結合	6	4, 6-ビス (ジメチルアミノ) -5-ピリミジル
1 1 1 7	同上	O	S	単結合	7	4, 6-ビス (ジメチルアミノ) -5-ピリミジル
1 1 1 8	同上	O	S	単結合	8	4, 6-ビス (ジメチルアミノ) -5-ピリミジル
1 1 1 9	同上	O	S	単結合	9	4, 6-ビス (ジメチルアミノ) -5-ピリミジル
1 1 2 0	同上	O	S	単結合	1 4	4, 6-ビス (ジメチルアミノ) -5-ピリミジル

[表 5 7]

化合物番号		X	Y	Z	n	H e t
1 1 2 1		S	S	単結合	1	4, 6-ビス (ジメチルアミノ) -5-ピリミジル
1 1 2 2	同上	S	S	単結合	2	4, 6-ビス (ジメチルアミノ) -5-ピリミジル
1 1 2 3	同上	S	S	単結合	3	4, 6-ビス (ジメチルアミノ) -5-ピリミジル
1 1 2 4	同上	S	S	単結合	4	4, 6-ビス (ジメチルアミノ) -5-ピリミジル
1 1 2 5	同上	S	S	単結合	5	4, 6-ビス (ジメチルアミノ) -5-ピリミジル
1 1 2 6	同上	S	S	単結合	6	4, 6-ビス (ジメチルアミノ) -5-ピリミジル
1 1 2 7	同上	S	S	単結合	7	4, 6-ビス (ジメチルアミノ) -5-ピリミジル
1 1 2 8	同上	S	S	単結合	8	4, 6-ビス (ジメチルアミノ) -5-ピリミジル
1 1 2 9	同上	S	S	単結合	9	4, 6-ビス (ジメチルアミノ) -5-ピリミジル
1 1 3 0	同上	S	S	単結合	1 4	4, 6-ビス (ジメチルアミノ) -5-ピリミジル
1 1 3 1	同上	NH	S	単結合	1	4, 6-ビス (ジメチルアミノ) -5-ピリミジル
1 1 3 2	同上	NH	S	単結合	2	4, 6-ビス (ジメチルアミノ) -5-ピリミジル
1 1 3 3	同上	NH	S	単結合	3	4, 6-ビス (ジメチルアミノ) -5-ピリミジル
1 1 3 4	同上	NH	S	単結合	4	4, 6-ビス (ジメチルアミノ) -5-ピリミジル
1 1 3 5	同上	NH	S	単結合	5	4, 6-ビス (ジメチルアミノ) -5-ピリミジル
1 1 3 6	同上	NH	S	単結合	6	4, 6-ビス (ジメチルアミノ) -5-ピリミジル
1 1 3 7	同上	NH	S	単結合	7	4, 6-ビス (ジメチルアミノ) -5-ピリミジル
1 1 3 8	同上	NH	S	単結合	8	4, 6-ビス (ジメチルアミノ) -5-ピリミジル
1 1 3 9	同上	NH	S	単結合	9	4, 6-ビス (ジメチルアミノ) -5-ピリミジル
1 1 4 0	同上	NH	S	単結合	1 4	4, 6-ビス (ジメチルアミノ) -5-ピリミジル


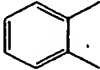
[表 58]

化合物番号		X	Y	Z	n	Het
1141		O	S	単結合	1	4,6-ビス (メチルチオ) -2-メチル-5-ピリミジル
1142	同上	O	S	単結合	2	4,6-ビス (メチルチオ) -2-メチル-5-ピリミジル
1143	同上	O	S	単結合	3	4,6-ビス (メチルチオ) -2-メチル-5-ピリミジル
1144	同上	O	S	単結合	4	4,6-ビス (メチルチオ) -2-メチル-5-ピリミジル
1145	同上	O	S	単結合	5	4,6-ビス (メチルチオ) -2-メチル-5-ピリミジル
1146	同上	O	S	単結合	6	4,6-ビス (メチルチオ) -2-メチル-5-ピリミジル
1147	同上	O	S	単結合	7	4,6-ビス (メチルチオ) -2-メチル-5-ピリミジル
1148	同上	O	S	単結合	8	4,6-ビス (メチルチオ) -2-メチル-5-ピリミジル
1149	同上	O	S	単結合	9	4,6-ビス (メチルチオ) -2-メチル-5-ピリミジル
1150	同上	O	S	単結合	14	4,6-ビス (メチルチオ) -2-メチル-5-ピリミジル
1151	同上	S	S	単結合	1	4,6-ビス (メチルチオ) -2-メチル-5-ピリミジル
1152	同上	S	S	単結合	2	4,6-ビス (メチルチオ) -2-メチル-5-ピリミジル
1153	同上	S	S	単結合	3	4,6-ビス (メチルチオ) -2-メチル-5-ピリミジル
1154	同上	S	S	単結合	4	4,6-ビス (メチルチオ) -2-メチル-5-ピリミジル
1155	同上	S	S	単結合	5	4,6-ビス (メチルチオ) -2-メチル-5-ピリミジル
1156	同上	S	S	単結合	6	4,6-ビス (メチルチオ) -2-メチル-5-ピリミジル
1157	同上	S	S	単結合	7	4,6-ビス (メチルチオ) -2-メチル-5-ピリミジル
1158	同上	S	S	単結合	8	4,6-ビス (メチルチオ) -2-メチル-5-ピリミジル
1159	同上	S	S	単結合	9	4,6-ビス (メチルチオ) -2-メチル-5-ピリミジル
1160	同上	S	S	単結合	14	4,6-ビス (メチルチオ) -2-メチル-5-ピリミジル


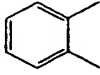
[表 5 9]

化合物番号		X	Y	Z	n	H e t
1 1 6 1		NH	S	単結合	1	4, 6-ビス (メチルチオ) -2-メチル-5-ピリミジル
1 1 6 2	同上	NH	S	単結合	2	4, 6-ビス (メチルチオ) -2-メチル-5-ピリミジル
1 1 6 3	同上	NH	S	単結合	3	4, 6-ビス (メチルチオ) -2-メチル-5-ピリミジル
1 1 6 4	同上	NH	S	単結合	4	4, 6-ビス (メチルチオ) -2-メチル-5-ピリミジル
1 1 6 5	同上	NH	S	単結合	5	4, 6-ビス (メチルチオ) -2-メチル-5-ピリミジル
1 1 6 6	同上	NH	S	単結合	6	4, 6-ビス (メチルチオ) -2-メチル-5-ピリミジル
1 1 6 7	同上	NH	S	単結合	7	4, 6-ビス (メチルチオ) -2-メチル-5-ピリミジル
1 1 6 8	同上	NH	S	単結合	8	4, 6-ビス (メチルチオ) -2-メチル-5-ピリミジル
1 1 6 9	同上	NH	S	単結合	9	4, 6-ビス (メチルチオ) -2-メチル-5-ピリミジル
1 1 7 0	同上	NH	S	単結合	1 4	4, 6-ビス (メチルチオ) -2-メチル-5-ピリミジル
1 1 7 1	同上	O	S	単結合	1	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1 1 7 2	同上	O	S	単結合	2	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1 1 7 3	同上	O	S	単結合	3	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1 1 7 4	同上	O	S	単結合	4	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1 1 7 5	同上	O	S	単結合	5	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1 1 7 6	同上	O	S	単結合	6	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1 1 7 7	同上	O	S	単結合	7	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1 1 7 8	同上	O	S	単結合	8	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1 1 7 9	同上	O	S	単結合	9	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1 1 8 0	同上	O	S	単結合	1 4	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル



[表 6 0]

化合物番号		X	Y	Z	n	Het
1181		S	S	単結合	1	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1182	同上	S	S	単結合	2	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1183	同上	S	S	単結合	3	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1184	同上	S	S	単結合	4	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1185	同上	S	S	単結合	5	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1186	同上	S	S	単結合	6	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1187	同上	S	S	単結合	7	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1188	同上	S	S	単結合	8	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1189	同上	S	S	単結合	9	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1190	同上	S	S	単結合	14	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1191	同上	NH	S	単結合	1	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1192	同上	NH	S	単結合	2	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1193	同上	NH	S	単結合	3	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1194	同上	NH	S	単結合	4	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1195	同上	NH	S	単結合	5	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1196	同上	NH	S	単結合	6	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1197	同上	NH	S	単結合	7	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1198	同上	NH	S	単結合	8	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1199	同上	NH	S	単結合	9	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1200	同上	NH	S	単結合	14	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル



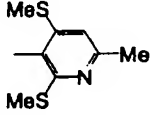
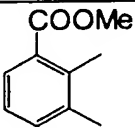
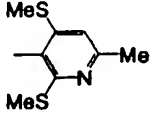

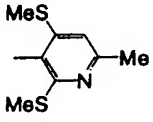
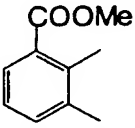
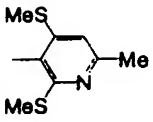

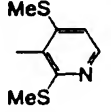
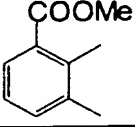
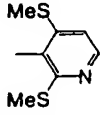

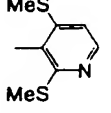
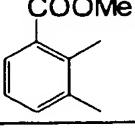
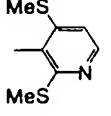

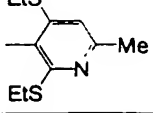
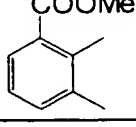
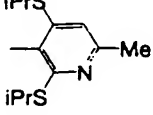
[表 6 1]

化合物番号		X	Y	Z	n	Het
1201		O	SO	単結合	5	2-メチルチオ-3-ピリジル
1202	同上	O	SO ₂	単結合	5	2-メチルチオ-3-ピリジル
1203	同上	O	NH	単結合	5	2-メチルチオ-3-ピリジル
1204	同上	S	SO	単結合	5	2-メチルチオ-3-ピリジル
1205	同上	S	SO ₂	単結合	5	2-メチルチオ-3-ピリジル
1206	同上	S	NH	単結合	5	2-メチルチオ-3-ピリジル
1207	同上	NH	SO	単結合	5	2-メチルチオ-3-ピリジル
1208	同上	NH	SO ₂	単結合	5	2-メチルチオ-3-ピリジル
1209	同上	NH	NH	単結合	5	2-メチルチオ-3-ピリジル
1210	同上	O	SO	NH	6	2-メチルチオ-3-ピリジル
1211	同上	O	SO ₂	NH	6	2-メチルチオ-3-ピリジル
1212	同上	O	NH	NH	6	2-メチルチオ-3-ピリジル
1213	同上	S	SO	NH	6	2-メチルチオ-3-ピリジル
1214	同上	S	SO ₂	NH	6	2-メチルチオ-3-ピリジル
1215	同上	S	NH	NH	6	2-メチルチオ-3-ピリジル
1216	同上	NH	SO	NH	6	2-メチルチオ-3-ピリジル
1217	同上	NH	SO ₂	NH	6	2-メチルチオ-3-ピリジル
1218	同上	NH	NH	NH	6	2-メチルチオ-3-ピリジル



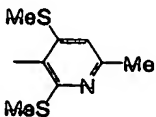

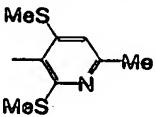

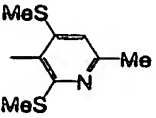

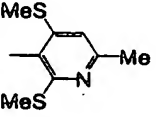

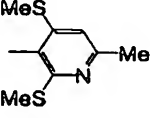

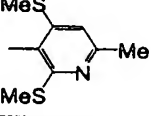

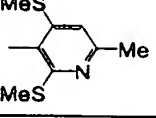

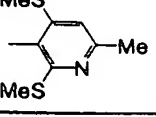

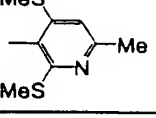

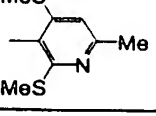
[表 6 2]

化合物番号		X	Y	Z	n	H e t
1 2 1 9		O	SO	単結合	5	2,4-ビス (メチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
1 2 2 0	同上	O	SO ₂	単結合	5	2,4-ビス (メチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
1 2 2 1	同上	O	NH	単結合	5	2,4-ビス (メチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
1 2 2 2	同上	S	SO	単結合	5	2,4-ビス (メチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
1 2 2 3	同上	S	SO ₂	単結合	5	2,4-ビス (メチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
1 2 2 4	同上	S	NH	単結合	5	2,4-ビス (メチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
1 2 2 5	同上	NH	SO	単結合	5	2,4-ビス (メチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
1 2 2 6	同上	NH	SO ₂	単結合	5	2,4-ビス (メチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
1 2 2 7	同上	NH	NH	単結合	5	2,4-ビス (メチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
1 2 2 8	同上	O	SO	NH	6	2,4-ビス (メチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
1 2 2 9	同上	O	SO ₂	NH	6	2,4-ビス (メチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
1 2 3 0	同上	O	NH	NH	6	2,4-ビス (メチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
1 2 3 1	同上	S	SO	NH	6	2,4-ビス (メチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
1 2 3 2	同上	S	SO ₂	NH	6	2,4-ビス (メチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
1 2 3 3	同上	S	NH	NH	6	2,4-ビス (メチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
1 2 3 4	同上	NH	SO	NH	6	2,4-ビス (メチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
1 2 3 5	同上	NH	SO ₂	NH	6	2,4-ビス (メチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
1 2 3 6	同上	NH	NH	NH	6	2,4-ビス (メチルチオ) -6-メチル-3-ピリジル


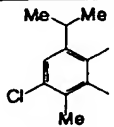
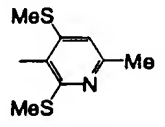
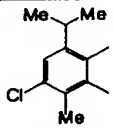
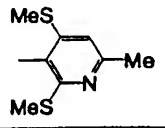
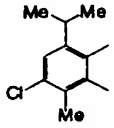
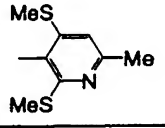
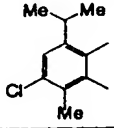
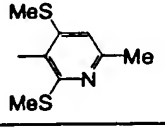
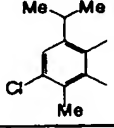
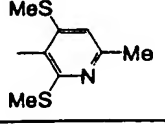
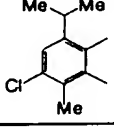
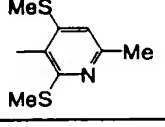
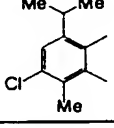
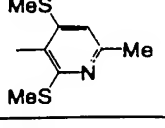
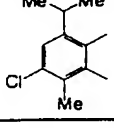
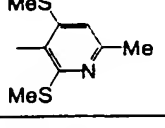
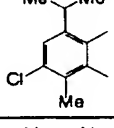
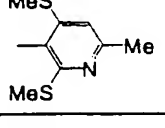
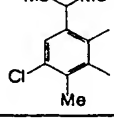
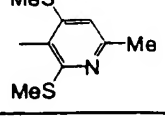
[表 6 3]

化合物番号		X	Y	Z	n	H e t
1 2 3 7		O	S	単結合	5	
1 2 3 8		O	S	単結合	5	
1 2 3 9		O	S	単結合	8	
1 2 4 0		O	S	単結合	8	
1 2 4 1		O	S	単結合	5	
1 2 4 2		O	S	単結合	5	
1 2 4 3		O	S	単結合	8	
1 2 4 4		O	S	単結合	8	
1 2 4 5		S	S	単結合	1	
1 2 4 6		NH	S	単結合	1	


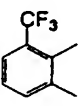
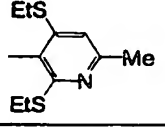
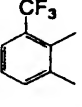
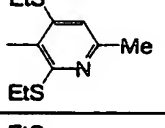
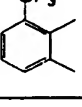
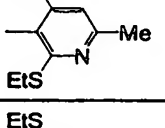
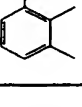
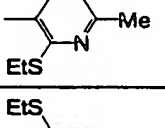
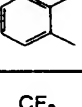
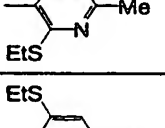
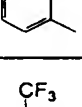
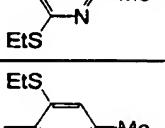
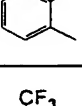
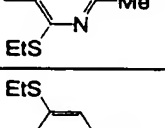
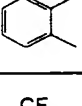
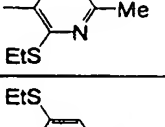
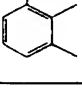
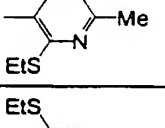
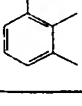
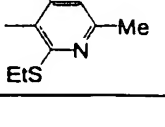
[表 6 4]

化合物番号		X	Y	Z	n	H e t
1 2 4 7		O	S	単結合	1	
1 2 4 8		O	S	単結合	2	
1 2 4 9		O	S	単結合	3	
1 2 5 0		O	S	単結合	4	
1 2 5 1		O	S	単結合	5	
1 2 5 2		O	S	単結合	6	
1 2 5 3		O	S	単結合	7	
1 2 5 4		O	S	単結合	8	
1 2 5 5		O	S	単結合	9	
1 2 5 6		O	S	単結合	1 4	


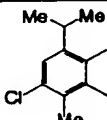
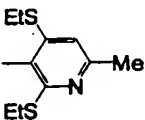
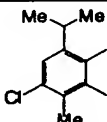
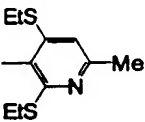
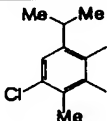
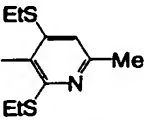
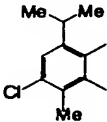
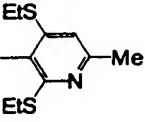
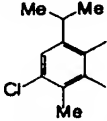
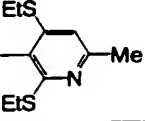
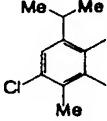
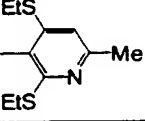
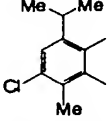
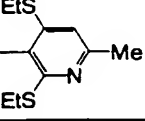
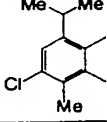
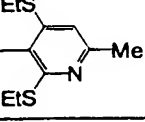
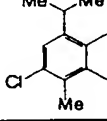
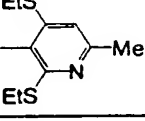
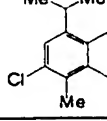
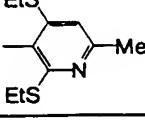
[表 6 5]

化合物番号		X	Y	Z	n	H e t
1 2 5 7		O	S	単結合	1	
1 2 5 8		O	S	単結合	2	
1 2 5 9		O	S	単結合	3	
1 2 6 0		O	S	単結合	4	
1 2 6 1		O	S	単結合	5	
1 2 6 2		O	S	単結合	6	
1 2 6 3		O	S	単結合	7	
1 2 6 4		O	S	単結合	8	
1 2 6 5		O	S	単結合	9	
1 2 6 6		O	S	単結合	1 4	



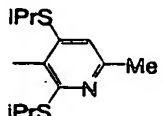

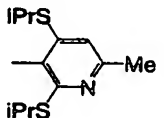

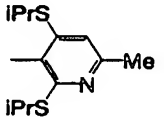

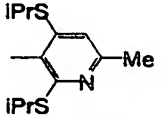

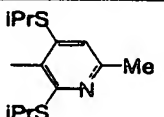

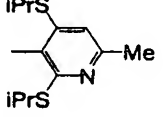

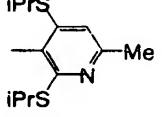

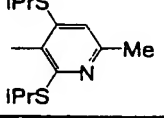

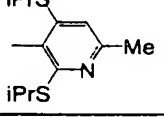

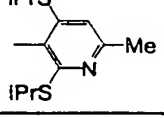
[表 6 6]

化合物番号		X	Y	Z	n	H e t
1 2 6 7		O	S	単結合	1	
1 2 6 8		O	S	単結合	2	
1 2 6 9		O	S	単結合	3	
1 2 7 0		O	S	単結合	4	
1 2 7 1		O	S	単結合	5	
1 2 7 2		O	S	単結合	6	
1 2 7 3		O	S	単結合	7	
1 2 7 4		O	S	単結合	8	
1 2 7 5		O	S	単結合	9	
1 2 7 6		O	S	単結合	1 4	


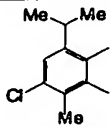
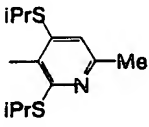
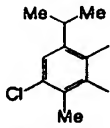
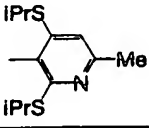
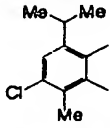
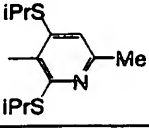
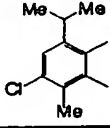
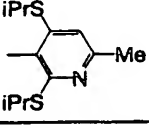
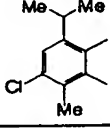
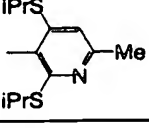
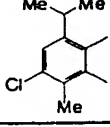
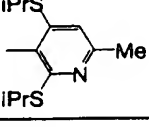
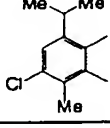
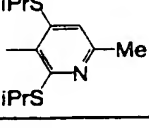
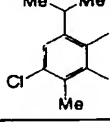
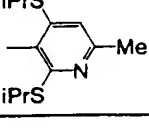
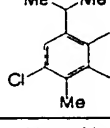
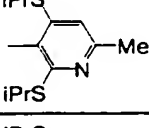
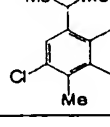
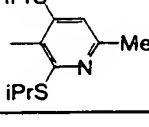
[表 6 7]

化合物番号		X	Y	Z	n	Het
1 2 7 7		O	S	単結合	1	
1 2 7 8		O	S	単結合	2	
1 2 7 9		O	S	単結合	3	
1 2 8 0		O	S	単結合	4	
1 2 8 1		O	S	単結合	5	
1 2 8 2		O	S	単結合	6	
1 2 8 3		O	S	単結合	7	
1 2 8 4		O	S	単結合	8	
1 2 8 5		O	S	単結合	9	
1 2 8 6		O	S	単結合	1 4	


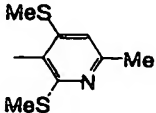

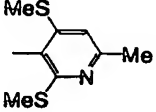

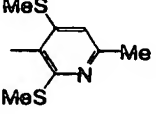

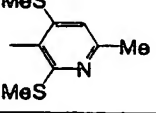

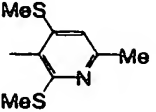
[表 6 8]

化合物番号		X	Y	Z	n	H e t
1 2 8 7		O	S	単結合	1	
1 2 8 8		O	S	単結合	2	
1 2 8 9		O	S	単結合	3	
1 2 9 0		O	S	単結合	4	
1 2 9 1		O	S	単結合	5	
1 2 9 2		O	S	単結合	6	
1 2 9 3		O	S	単結合	7	
1 2 9 4		O	S	単結合	8	
1 2 9 5		O	S	単結合	9	
1 2 9 6		O	S	単結合	1 4	


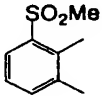
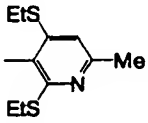
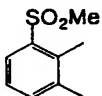
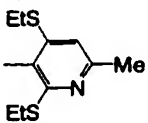
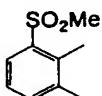
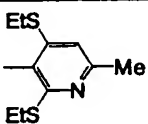
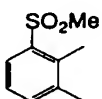
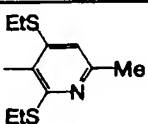
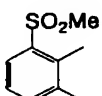
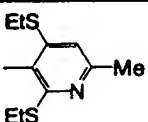
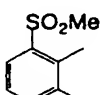
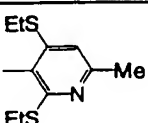
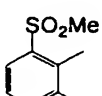
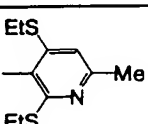
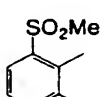
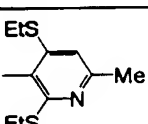
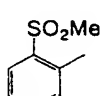
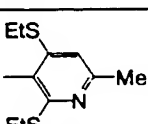
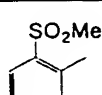
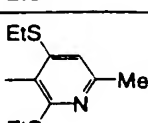
[表 6 9]

化合物番号		X	Y	Z	n	H e t
1 2 9 7		O	S	単結合	1	
1 2 9 8		O	S	単結合	2	
1 2 9 9		O	S	単結合	3	
1 3 0 0		O	S	単結合	4	
1 3 0 1		O	S	単結合	5	
1 3 0 2		O	S	単結合	6	
1 3 0 3		O	S	単結合	7	
1 3 0 4		O	S	単結合	8	
1 3 0 5		O	S	単結合	9	
1 3 0 6		O	S	単結合	1 4	



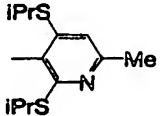

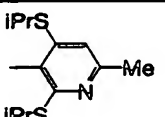

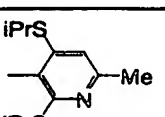

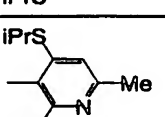

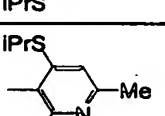

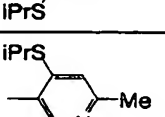

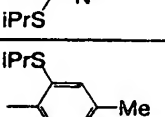

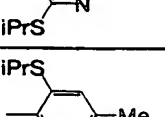

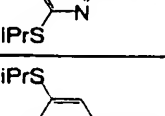

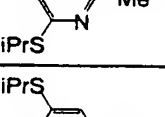
[表 70]

化合物番号		X	Y	Z	n	H e t
1 3 0 7		O	S	単結合	1	
1 3 0 8		O	S	単結合	2	
1 3 0 9		O	S	単結合	3	
1 3 1 0		O	S	単結合	4	
1 3 1 1		O	S	単結合	5	


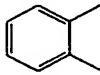
[表 7 1]

化合物番号		X	Y	Z	n	H e t
1 3 1 7		O	S	単結合	1	
1 3 1 8		O	S	単結合	2	
1 3 1 9		O	S	単結合	3	
1 3 2 0		O	S	単結合	4	
1 3 2 1		O	S	単結合	5	
1 3 2 2		O	S	単結合	6	
1 3 2 3		O	S	単結合	7	
1 3 2 4		O	S	単結合	8	
1 3 2 5		O	S	単結合	9	
1 3 2 6		O	S	単結合	1 4	

[表 7 2]

化合物番号		X	Y	Z	n	H e t
1 3 2 7		O	S	単結合	1	
1 3 2 8		O	S	単結合	2	
1 3 2 9		O	S	単結合	3	
1 3 3 0		O	S	単結合	4	
1 3 3 1		O	S	単結合	5	
1 3 3 2		O	S	単結合	6	
1 3 3 3		O	S	単結合	7	
1 3 3 4		O	S	単結合	8	
1 3 3 5		O	S	単結合	9	
1 3 3 6		O	S	単結合	1 4	

[表 7 3]

化合物番号		X	Y	Z	n	H e t
1 3 3 7		O	S	単結合	1	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1 3 3 8	同上	O	S	単結合	2	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1 3 3 9	同上	O	S	単結合	3	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1 3 4 0	同上	O	S	単結合	4	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1 3 4 1	同上	O	S	単結合	5	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1 3 4 2	同上	O	S	単結合	6	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1 3 4 3	同上	O	S	単結合	7	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1 3 4 4	同上	O	S	単結合	8	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1 3 4 5	同上	O	S	単結合	9	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1 3 4 6	同上	O	S	単結合	1 4	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1 3 4 7	同上	S	S	単結合	1	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1 3 4 8	同上	S	S	単結合	2	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1 3 4 9	同上	S	S	単結合	3	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1 3 5 0	同上	S	S	単結合	4	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1 3 5 1	同上	S	S	単結合	5	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1 3 5 2	同上	S	S	単結合	6	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1 3 5 3	同上	S	S	単結合	7	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1 3 5 4	同上	S	S	単結合	8	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1 3 5 5	同上	S	S	単結合	9	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1 3 5 6	同上	S	S	単結合	1 4	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル

[表 7 4]

化合物番号		X	Y	Z	n	Het
1 3 5 7		NH	S	単結合	1	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1 3 5 8	同上	NH	S	単結合	2	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1 3 5 9	同上	NH	S	単結合	3	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1 3 6 0	同上	NH	S	単結合	4	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1 3 6 1	同上	NH	S	単結合	5	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1 3 6 2	同上	NH	S	単結合	6	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1 3 6 3	同上	NH	S	単結合	7	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1 3 6 4	同上	NH	S	単結合	8	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1 3 6 5	同上	NH	S	単結合	9	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1 3 6 6	同上	NH	S	単結合	1 4	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1 3 6 7	同上	O	S	単結合	1	5-メチルチオ-2-ピリジル
1 3 6 8	同上	O	S	単結合	2	5-メチルチオ-2-ピリジル
1 3 6 9	同上	O	S	単結合	3	5-メチルチオ-2-ピリジル
1 3 7 0	同上	O	S	単結合	4	5-メチルチオ-2-ピリジル
1 3 7 1	同上	O	S	単結合	5	5-メチルチオ-2-ピリジル
1 3 7 2	同上	O	S	単結合	6	5-メチルチオ-2-ピリジル
1 3 7 3	同上	O	S	単結合	7	5-メチルチオ-2-ピリジル
1 3 7 4	同上	O	S	単結合	8	5-メチルチオ-2-ピリジル
1 3 7 5	同上	O	S	単結合	9	5-メチルチオ-2-ピリジル
1 3 7 6	同上	O	S	単結合	1 4	5-メチルチオ-2-ピリジル


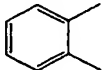
[表 7 5]

化合物番号		X	Y	Z	n	H e t
1 3 7 7		S	S	単結合	1	5-メチルチオ-2-ピリジル
1 3 7 8	同上	S	S	単結合	2	5-メチルチオ-2-ピリジル
1 3 7 9	同上	S	S	単結合	3	5-メチルチオ-2-ピリジル
1 3 8 0	同上	S	S	単結合	4	5-メチルチオ-2-ピリジル
1 3 8 1	同上	S	S	単結合	5	5-メチルチオ-2-ピリジル
1 3 8 2	同上	S	S	単結合	6	5-メチルチオ-2-ピリジル
1 3 8 3	同上	S	S	単結合	7	5-メチルチオ-2-ピリジル
1 3 8 4	同上	S	S	単結合	8	5-メチルチオ-2-ピリジル
1 3 8 5	同上	S	S	単結合	9	5-メチルチオ-2-ピリジル
1 3 8 6	同上	S	S	単結合	1 4	5-メチルチオ-2-ピリジル
1 3 8 7	同上	NH	S	単結合	1	5-メチルチオ-2-ピリジル
1 3 8 8	同上	NH	S	単結合	2	5-メチルチオ-2-ピリジル
1 3 8 9	同上	NH	S	単結合	3	5-メチルチオ-2-ピリジル
1 3 9 0	同上	NH	S	単結合	4	5-メチルチオ-2-ピリジル
1 3 9 1	同上	NH	S	単結合	5	5-メチルチオ-2-ピリジル
1 3 9 2	同上	NH	S	単結合	6	5-メチルチオ-2-ピリジル
1 3 9 3	同上	NH	S	単結合	7	5-メチルチオ-2-ピリジル
1 3 9 4	同上	NH	S	単結合	8	5-メチルチオ-2-ピリジル
1 3 9 5	同上	NH	S	単結合	9	5-メチルチオ-2-ピリジル
1 3 9 6	同上	NH	S	単結合	1 4	5-メチルチオ-2-ピリジル


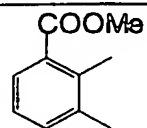
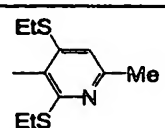
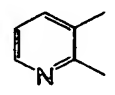
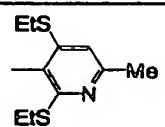
[表 7 6]

化合物番号		X	Y	Z	n	Het
1 3 9 7		O	S	単結合	1	2, 4, 6-トリス (メチルチオ) -5-ピリミジル
1 3 9 8	同上	O	S	単結合	2	2, 4, 6-トリス (メチルチオ) -5-ピリミジル
1 3 9 9	同上	O	S	単結合	3	2, 4, 6-トリス (メチルチオ) -5-ピリミジル
1 4 0 0	同上	O	S	単結合	4	2, 4, 6-トリス (メチルチオ) -5-ピリミジル
1 4 0 1	同上	O	S	単結合	5	2, 4, 6-トリス (メチルチオ) -5-ピリミジル
1 4 0 2	同上	O	S	単結合	6	2, 4, 6-トリス (メチルチオ) -5-ピリミジル
1 4 0 3	同上	O	S	単結合	7	2, 4, 6-トリス (メチルチオ) -5-ピリミジル
1 4 0 4	同上	O	S	単結合	8	2, 4, 6-トリス (メチルチオ) -5-ピリミジル
1 4 0 5	同上	O	S	単結合	9	2, 4, 6-トリス (メチルチオ) -5-ピリミジル
1 4 0 6	同上	O	S	単結合	1 4	2, 4, 6-トリス (メチルチオ) -5-ピリミジル
1 4 0 7	同上	S	S	単結合	1	2, 4, 6-トリス (メチルチオ) -5-ピリミジル
1 4 0 8	同上	S	S	単結合	2	2, 4, 6-トリス (メチルチオ) -5-ピリミジル
1 4 0 9	同上	S	S	単結合	3	2, 4, 6-トリス (メチルチオ) -5-ピリミジル
1 4 1 0	同上	S	S	単結合	4	2, 4, 6-トリス (メチルチオ) -5-ピリミジル
1 4 1 1	同上	S	S	単結合	5	2, 4, 6-トリス (メチルチオ) -5-ピリミジル
1 4 1 2	同上	S	S	単結合	6	2, 4, 6-トリス (メチルチオ) -5-ピリミジル
1 4 1 3	同上	S	S	単結合	7	2, 4, 6-トリス (メチルチオ) -5-ピリミジル
1 4 1 4	同上	S	S	単結合	8	2, 4, 6-トリス (メチルチオ) -5-ピリミジル
1 4 1 5	同上	S	S	単結合	9	2, 4, 6-トリス (メチルチオ) -5-ピリミジル
1 4 1 6	同上	S	S	単結合	1 4	2, 4, 6-トリス (メチルチオ) -5-ピリミジル

[表 7 7]

化合物番号		X	Y	Z	n	H e t
1 4 1 7		NH	S	単結合	1	2, 4, 6-トリス (メチルチオ) -5-ピリミジル
1 4 1 8	同上	NH	S	単結合	2	2, 4, 6-トリス (メチルチオ) -5-ピリミジル
1 4 1 9	同上	NH	S	単結合	3	2, 4, 6-トリス (メチルチオ) -5-ピリミジル
1 4 2 0	同上	NH	S	単結合	4	2, 4, 6-トリス (メチルチオ) -5-ピリミジル
1 4 2 1	同上	NH	S	単結合	5	2, 4, 6-トリス (メチルチオ) -5-ピリミジル
1 4 2 2	同上	NH	S	単結合	6	2, 4, 6-トリス (メチルチオ) -5-ピリミジル
1 4 2 3	同上	NH	S	単結合	7	2, 4, 6-トリス (メチルチオ) -5-ピリミジル
1 4 2 4	同上	NH	S	単結合	8	2, 4, 6-トリス (メチルチオ) -5-ピリミジル
1 4 2 5	同上	NH	S	単結合	9	2, 4, 6-トリス (メチルチオ) -5-ピリミジル
1 4 2 6	同上	NH	S	単結合	1 4	2, 4, 6-トリス (メチルチオ) -5-ピリミジル

[表 7 8]

化合物番号		X	Y	Z	n	H e t
1 4 2 7		O	S	単結合	1	
1 4 2 8		O	S	単結合	1	

本発明の一般式（I）で示される化合物は、ACAT阻害作用及び／又は細胞内コレステロール輸送阻害作用を有し、高脂血症治療剤又は動脈硬化治療剤などとして医療分野で有用である。特に、本発明の化合物は血管壁に存在するタイプのACAT酵素を選択的に阻害する作用を示すことから、非選択的なACAT阻害剤に比べて副作用が少ないことが期待され、医薬の有効成分として好ましい。

本発明の医薬組成物は、一般式（I）で示される化合物、その酸付加塩又は溶媒和物を有効成分とするものであり、この有効成分の少なくとも1種を治療上有効な量と、製薬上許容される担体とからなるものである。

本発明の医薬組成物は、一般式（I）で示される化合物、その酸付加塩又は溶媒和物を有効成分とするものであり、この有効成分の少なくとも1種を単独で、又は、他の薬学的に許容される賦形剤、結合剤、担体、希釈剤などを当業者にはよく知られている担体を用いて、錠剤、カプセル剤、顆粒剤、粉末剤、注射剤、坐剤等の、投与可能な剤型とすることができる。これらの製剤は公知の方法で製造することができる。例えば、経口投与用製剤とする場合には、一般式（I）で示される化合物を、澱粉、マンニトール、乳糖等の賦形剤：カルボキシメチルセルロースナトリウム、ヒドロキシプロピルセルロース等の結合剤：結晶セルロース、カルボキシメチルセルロースカルシウム等の崩壊剤：タルク、ステリン酸マグネシウム等の滑沢剤：軽質無水ケイ酸等の流動性向上剤などを適宜組み合わせて処方することにより製造することができる。

本発明の医薬組成物は、経口投与又は非経口投与により投与することができる。

本発明の医薬組成物の投与量は、患者の体重、年齢、性別、症状等によって異なるが、一般式（I）で示される化合物として、通常成人の場合、1日1～1000mg、好ましくは5～200mgを、1日1～3回に分けて投与するのが好ましい。

本発明の一般式（I）で示される化合物のACAT阻害作用を次に示す実験例で試験した。

実験例1（ACAT阻害作用）

1% コレステロール食で8週間飼育したウサギの胸部大動脈から常法によってミクロソームを調製し、0.15 M リン酸緩衝液 (pH 7.4) に懸濁して酵素溶液とした。小腸由来の酵素溶液は、正常食のウサギ小腸から調製した。

ACAT 阻害活性の測定は、J. G. ハイダー (J. Lipid Res., 24, 1127-1134, 1983) の方法を改変して行った。すなわち、 ^{14}C -Oleoyl-CoA ($40\text{ }\mu\text{M}$ 、 60000 dpm)、及び、ウシ血清アルブミン (2.4 mg/ml) を含む0.15 M リン酸緩衝液 (pH 7.4) $88\text{ }\mu\text{l}$ に、ジメチルスルホキシド (DMSO) に溶解した試験化合物 $2\text{ }\mu\text{l}$ を添加し、 37°C で5分間インキュベートした。

この液に、酵素溶液 $10\text{ }\mu\text{l}$ を加えて 37°C で5分間 (小腸の場合は3分間。) 反応した後、クロロホルム/メタノール (2/1) 3 ml 、及び、0.04 N 塩酸 0.5 ml を加えて反応を停止し、脂質を抽出した。溶媒層を濃縮乾固した後、ヘキサンに溶解して TLC プレート (メルク社製) にスポットした。ヘキサン: エーテル: 酢酸 (75: 25: 1) で展開した。

生成したコレステロールエステル画分の放射活性を BAS 2000 (富士フィルム社製) で測定し、DMSOのみを添加したコントロールとの対比計算より IC₅₀ 値を求めた。結果を表 7.9 に示した。

【表 7 9】

試験化合物 (化合物番号)	血管壁由来の酵素 I C ₅₀ (μM)	小腸由来の酵素 I C ₅₀ (μM)	I C ₅₀ (小腸) ／ I C ₅₀ (血管壁)
7 9 5	0. 0 2 8	0. 0 1 6	0. 6
8 1 1	0. 0 1 4	0. 3 8	2 7. 1
8 1 5	0. 0 1 4	0. 0 1 7	1. 2
8 1 8	0. 0 0 5 6	0. 0 1 6	2. 9
8 3 1	0. 6 3	0. 6 1	1. 0
対照 (1)	0. 4 5	0. 8 7	1. 9
対照 (2)	0. 0 4 7	0. 1 3	2. 8
対照 (3)	0. 0 3 4	0. 0 5 6	1. 7
対照 (4)	0. 0 2 6	0. 0 3 7	1. 4
対照 (5)	0. 0 1	0. 0 6 5	6. 5
対照 (6)	0. 1 1	0. 5 1	4. 6

実験例 2 (J 7 4.4 細胞および H e p G 2 細胞における A C A T 阻害作用 (抗泡沫化作用))

J 7 7 4 細胞または H e p G 2 細胞を 24 穴プレートに播種し、J 7 7 4 細胞は D M E M、H e p G 2 細胞は M E M 培養液 (それぞれ 10 % 牛胎児血清を含む) を用い、37℃で、5 % C O₂ インキュベーターにて 24 時間培養した。

10 μ g / m l の 25-OH コレステロール、及び、検体を含む各培養液 0.5 m l に交換後、さらに 18 時間培養した。

培地を除き P B S で 2 回洗浄後 1.5 m l のヘキサン : イソプロパノール (3 : 2) で抽出し、濃縮乾固した。抽出物を 0.2 m l の 10 % T r i t o n X - 100 を含むイソプロパノールに溶解し、総コレステロール (T C) 及び遊離コレステロール (F C) を、それぞれコレステロール E テストワコー (和光純薬工業)、遊離コレステロール E テストワコー (和光純薬工業) で測定した。

細胞の抽出残さを 0.25 m l の 2 N N a O H に 37℃で、30 分間で可溶化し、B C A P r o t e i n A s s a y R e a g e n t (P i e r c e) で蛋白量を測定した。

T C と F C の差から蛋白あたりのコレステロールエステル量を算出し、コントロールとの対比計算から I C₅₀ 値を求めた。結果を表 80 に示した。

【表 8 0】

試験化合物 (化合物番号)	J774 細胞酵素 I C ₅₀ (μM)	HepG2 由来酵素 I C ₅₀ (μM)	I C ₅₀ (HepG2) ／ I C ₅₀ (J774)
7 9 5	0. 0 5 0	0. 3 5	7. 0
7 9 7	0. 0 0 3 6	0. 0 2 9	8. 1
8 1 1	0. 0 5 0	1. 8	3 6. 0
8 1 5	0. 1 2	2. 6	2 1. 7
8 1 8	0. 0 6 2	0. 0 6 3	1. 0
8 3 1	0. 0 5 7	5. 4	9 4. 7
1 2 5 3	0. 0 0 4 1	0. 0 0 4 4	1. 1
1 2 8 2	0. 0 0 3 2	0. 0 0 6 2	1. 9
1 2 9 2	0. 0 0 2 7	0. 0 3 0	1 1. 1
1 2 9 4	0. 0 0 4 2	0. 0 0 2 4	0. 6
1 3 0 2	0. 0 0 2 1	0. 0 1 5	7. 1
対照 (1)	0. 5 6	5. 3	9. 5
対照 (2)	0. 5 8	1. 1	1. 9
対照 (3)	0. 3 2	1. 3	4. 3
対照 (4)	0. 1 2	0. 7 5	6. 3
対照 (5)	1. 9	1. 6	0. 8
対照 (6)	0. 2 8	9. 1	3 2. 8

対照化合物として、下記の対照化合物（１）～（６）を同様な方法で試験した結果も表６４、及び、表６５に併せて示されている。対照化合物として用いた対照化合物（１）～（６）は、次のものである。

対照化合物（１）：５－〔２－（２－（４－フルオロフェニル）エチル）－３－（１－メチル－１Ｈ－イミダゾール－２－イル）－２Ｈ－１－ベンゾピラン－６－イル〕オキシ－２，２－ジメチル－Ｎ－（２，６－ジイソプロピルフェニル）ペンタンアミド（WO 92/09582）

対照化合物（２）：（＋）－（Ｓ）－２－〔５－（３，５－ジメチルピラゾール－１－イル）ペンタスルフィニル〕－４，５－ジフェニルイミダゾール（EP 523941）

対照化合物（３）：Ｎ－（２，２，５，５－テトラメチル－１，３－ジオキサ－４－イルカルボニル）－β－アラニン－２（Ｓ）－〔Ｎ’－（２，２－ジメチルプロピル）－Ｎ’－ノニルウレイド〕－１（Ｓ）－シクロヘキシルエステル（EP 421441）

対照化合物（４）：〔５－（４，５－ジフェニル－１Ｈ－イミダゾール－２－イルチオ）ペンチル〕－Ｎ－ヘプチル－２－ベンゾオキサゾールアミン（WO 93/23392）

対照化合物（５）：６－（ベンゾオキサゾール－２－イルチオ）－Ｎ－（２，６－ジイソプロピルフェニル）ヘキサンアミド
（特願平９－８８６６０号の化合物）

対照化合物（６）：２－〔４－〔２－（ベンズイミダゾール－２－イルチオ）エチル〕ピペラジン－１－イル〕－Ｎ－（２，６－ジイソプロピルフェニル）アセトアミド
（特願平９－１４９８９２号の化合物）

実施例

以下に、実施例により本発明を具体的に説明するが、本発明はこれらの実施例に限定されるものではない。

実施例 1 (表中の化合物番号 5 の化合物)

6-(ベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-(2-メチルチオ-3-ピリジル)ヘキサンアミドの製造:

ナトリウムチオメトキシド (2.10 g, 28.5 mmol) のメタノール (30 ml) 溶液に、氷冷下で 2-クロロ-3-ニトロピリジン (4.30 g, 27.1 mmol) のメタノール (50 ml) 溶液を滴下し、17 時間攪拌後、反応混合物に水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後溶媒を留去し、得られた結晶を酢酸エチル-ヘキサンより再結晶し、2-メチルチオ-3-ニトロピリジン 2.93 g (収率 64 %) を黄色針状晶として得た。

このニトロピリジン (851 mg, 5.0 mmol) を酢酸 (35 ml) と濃塩酸 (1.4 ml) の混合溶媒に溶解し、氷冷下で亜鉛 (3.92 g, 60 mmol) を少量ずつ加えた。30 分間攪拌後、反応混合物を濾過し、濾液を炭酸水素ナトリウム水溶液で中和し、塩化メチレンで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して、3-アミノ-2-メチルチオピリジン 600 mg (収率 86 %) を淡黄色油状物として得た。

このアミノピリジン (600 mg, 4.28 mmol) の THF (7 ml) 溶液にトリエチルアミン (520 mg, 5.14 mmol) を加え、次いで氷冷下で 6-ブロモヘキサン酸クロリド (1.10 g, 5.14 mmol) をゆっくりと滴下し、室温で 3 時間攪拌した。反応混合物を水で希釈後、酢酸エチルで抽出し、有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して得た粗生成物を、シリカゲルクロマトグラフィー (シリカゲル 125 g; 展開溶媒: ヘキサン: 酢酸エチル = 6:1 → 3:1 → 2:1) で精製して、6-ブロモ-N-(2-メチルチオ-3-ピリジル)ヘキサンアミド 1.08 g (収率 79 %) を無色針状晶 (融点: 66-67 °C) として得た。

このアミド (159 mg, 0.5 mmol) と 2-メルカプトベンゾオキサゾール (83 mg, 0.55 mmol) の DMF (2 ml) 溶液に、18-クラウン-6 (13 mg, 0.05 mmol) と炭酸カリウム (83 mg, 0.6 mmol) を加え、80 °C で、3 時間攪拌した。反応混合物を水で希釈後、酢酸エチルで抽出し、有機層を水、飽和食塩水で順次洗

淨し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して得た粗生成物を、シリカゲルクロマトグラフィー（シリカゲル 20 g, 展開溶媒；ヘキサン：酢酸エチル = 5 : 2 → 2 : 1）で精製して目的化合物 156 mg（収率 81 %）を無色針状晶として得た。

融点 : 127 - 128 °C

I R (KBr) cm^{-1} : 3447, 3265, 1654,
1522, 1508.

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

1.58 - 1.65 (2H, m), 1.83 (2H, quint, $J = 7.4$ Hz),
1.92 (2H, quint, $J = 7.4$ Hz), 2.46 (2H, t, $J = 7.4$ Hz),
2.62 (3H, s), 3.34 (2H, t, $J = 7.4$ Hz),
7.06 (1H, dd, $J = 8.1, 4.6$ Hz), 7.21 - 7.30 (3H, m),
7.44 (1H, m), 7.59 (1H, m), 8.26 (1H, d, $J = 4.6$ Hz),
8.28 (1H, d, $J = 8.1$ Hz).

EIMS m/z (relative intensity) : 387 (M^+), 165 (100).

元素分析 : $\text{C}_{19}\text{H}_{21}\text{N}_3\text{O}_2\text{S}_2$ として

計算値 : C, 58.89; H, 5.46; N, 10.84; S, 16.55.

実測値 : C, 58.92; H, 5.43; N, 10.78; S, 16.55.

実施例 2（表中の化合物番号 8 の化合物）

9 - (ベンゾオキサゾール - 2 - イルチオ) - N - (2 - メチルチオ - 3 - ピリジル) ノナンアミドの製造 :

6 - ブロモヘキサン酸クロリドの代わりに、9 - ブロモノナン酸クロリドを用いて、実施例 1 と同様に反応・処理し、9 - ブロモ - N - (2 - メチルチオ - 3 - ピリジル) ノナンアミドを得た。

このアミド (90 mg, 0.25 mmol) と 2 - メルカプトベンゾオキサゾール (38 mg, 0.25 mmol) の DMF (5 ml) 溶液に、炭酸カリウム (42 mg, 0.30 mmol)、18 - クラウン - 6 (7 mg, 0.03 mmol) を加え、80 °C で、3 時間攪拌した。反応混合物を放冷後、酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して得た残渣を、酢酸エチル - ヘキサンより

再結晶し、目的化合物 83 mg (収率 77 %) を無色粉末晶として得た。

融点 : 84 - 85 °C

I R (K B r) cm^{-1} : 3465, 3276, 2926,
1664, 1505

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

1.35 - 1.53 (8H, m), 1.72 - 1.77 (2H, m),
1.80 - 1.87 (2H, m), 2.42 (2H, t, $J = 7.3 \text{ Hz}$),
2.63 (3H, s), 3.31 (2H, t, $J = 7.4 \text{ Hz}$),
7.06 (1H, dd, $J = 8.0, 4.7 \text{ Hz}$), 7.21 - 7.30 (3H, m),
7.43 (1H, dd, $J = 7.0, 0.6 \text{ Hz}$), 7.59 (1H, dd, $J = 7.6, 0.6 \text{ Hz}$),
8.25 (1H, d, $J = 4.7 \text{ Hz}$), 8.31 (1H, d, $J = 7.8 \text{ Hz}$).

E I M S m/z (relative intensity) : 429 (M^+), 297 (100).

元素分析 : $\text{C}_{22}\text{H}_{27}\text{N}_3\text{O}_2\text{S}_2$ として

計算値 : C, 61.51; H, 6.33; N, 9.78; S, 14.93.

実測値 : C, 61.51; H, 6.28; N, 9.64; S, 14.99.

実施例 3 (表中の化合物番号 15 の化合物)

6 - (ベンゾチアゾール - 2 - イルチオ) - N - (2 - メチルチオ - 3 - ピリジル) ヘキサナムイドの製造 :

2 - メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに 2 - メルカプトベンゾチアゾールを用いて実施例 1 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 118 - 119 °C

I R (K B r) cm^{-1} : 3429, 3265, 1654,
1522, 1508.

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

1.57 - 1.65 (2H, m), 1.83 (2H, quint, $J = 7.4 \text{ Hz}$),
1.91 (2H, quint, $J = 7.4 \text{ Hz}$), 2.46 (2H, t, $J = 7.4 \text{ Hz}$),
2.61 (3H, s), 3.38 (2H, t, $J = 7.4 \text{ Hz}$),
7.06 (1H, dd, $J = 8.1, 4.9 \text{ Hz}$), 7.25 (1H, br s), 7.29 (1H, m),

7.41 (1H, m), 7.75 (1H, m), 7.86 (1H, m),

8.25 (1H, d, $J = 4.9$ Hz), 8.29 (1H, d, $J = 8.1$ Hz).

EIMS m/z (relative intensity): 403 (M^+), 223 (100).

元素分析 : $C_{19}H_{21}N_3OS_3$ として

計算値 : C, 56.55; H, 5.24; N, 10.41; S, 23.83.

実測値 : C, 56.69; H, 5.30; N, 10.24; S, 23.77.

実施例 4 (表中の化合物番号 18 の化合物)

9 - (ベンゾチアゾール - 2 - イルチオ) - N - (2 - メチルチオ - 3 - ピリジル) ノナンアミドの製造 :

2 - メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに 2 - メルカプトベンゾチアゾールを用いて実施例 2 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

融点 : 107 - 108 °C

IR (KBr) cm^{-1} : 3448, 3256, 2923,
1656, 1525.

1H -NMR (d6-DMSO) δ :

1.24 - 1.34 (6H, m), 1.36 - 1.43 (2H, m),

1.54 - 1.59 (2H, m), 1.69 - 1.77 (2H, m),

2.26 (2H, t, $J = 7.4$ Hz), 2.40 (3H, s), 3.28 (2H, t, $J = 7.2$ Hz),

7.01 (1H, dd, $J = 7.8, 4.6$ Hz), 7.26 (1H, dt, $J = 8.1, 1.2$ Hz),

7.36 (1H, dt, $J = 7.3, 1.2$ Hz), 7.58 (1H, dd, $J = 7.8, 1.5$ Hz),

7.74 (1H, d, $J = 8.1$ Hz), 7.85 (1H, dd, $J = 7.3, 1.2$ Hz),

8.21 (1H, dd, $J = 4.6, 1.5$ Hz), 8.73 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 445 (M^+), 297 (100).

元素分析 : $C_{22}H_{27}N_3OS_3$ として

計算値 : C, 59.29; H, 6.11; N, 9.43; S, 21.58.

実測値 : C, 59.12; H, 6.02; N, 9.25; S, 21.62.

実施例 5 (表中の化合物番号 25 の化合物)

6 - (ベンズイミダゾール-2-イルチオ) - N - (2-メチルチオ-3-ピリジル) ヘキサンアミドの製造:

2-メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカプトベンズイミダゾールを用いて実施例1と同様に反応・処理し、目的化合物を淡黄色針状晶として得た。

融点: 121 - 123 °C

IR (KBr) cm^{-1} : 3386, 3276, 1658,
1511, 1398.

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

1.52 - 1.60 (2H, m), 1.74 - 1.86 (4H, m),
2.42 (2H, t, $J = 7.2$ Hz), 2.60 (3H, s),
3.32 (2H, t, $J = 7.2$ Hz), 7.05 (1H, dd, $J = 8.1, 4.9$ Hz),
7.18 - 7.19 (2H, m), 7.32 (1H, br s),
7.36 (1H, br s), 7.66 (1H, br s),
8.23 - 8.26 (2H, m), 9.84 (1H, br s).

EMS m/z (relative intensity): 386 (M^+), 205 (100).

元素分析: $\text{C}_{19}\text{H}_{22}\text{N}_4\text{O}_2\text{S}_2$ として

計算値: C, 59.04; H, 5.74; N, 14.49; S, 16.59.

実測値: C, 59.06; H, 5.76; N, 14.35; S, 16.57.

実施例6 (表中の化合物番号28の化合物)

9 - (ベンズイミダゾール-2-イルチオ) - N - (2-メチルチオ-3-ピリジル) ノナンアミドの製造:

2-メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカプトベンズイミダゾールを用いて実施例2と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

IR (KBr) cm^{-1} : 3260, 2929, 2851,
1664, 1519, 1394.

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

1.31 - 1.47 (6H, m), 1.57 - 1.61 (2H, m),
1.69 - 1.79 (4H, m), 2.42 (2H, t, $J = 7.2$ Hz), 2.63 (3H, s),
3.32 (2H, t, $J = 7.4$ Hz), 7.06 (1H, dd, $J = 8.1, 4.6$ Hz),
7.18 - 7.23 (4H, m), 7.67 (1H, br s),
8.26 (1H, d, $J = 4.6$ Hz), 8.30 (1H, d, $J = 7.8$ Hz),
9.31 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 428 (M^+), 164 (100).

実施例 7 (表中の化合物番号 158 の化合物)

9 - (ベンゾオキサゾール-2-イルチオ) - N - (4-メチル-2-メチルチオ-3-ピリジル) ノナンアミドの製造:

2-クロロ-3-ニトロピリジンの代わりに2-クロロ-4-メチル-3-ニトロピリジンを用いて実施例 1 と同様に反応・処理し、4-メチル-2-メチルチオ-3-ニトロピリジンを得た。このニトロピリジン (474 mg, 2.57 mmol) を酢酸 (18 ml) と濃塩酸 (0.7 ml) の混合溶媒に溶解し、氷冷下で亜鉛 (2.02 g, 30.88 mmol) を少量ずつ加えた。30 分間攪拌後、反応混合物を濾過し、濾液を炭酸水素ナトリウム水溶液で中和し、塩化メチレンで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して、3-アミノ-4-メチル-2-メチルチオピリジン 307 mg (収率 77 %) を無色結晶として得た。

このアミノピリジン (307 mg, 1.99 mmol) のクロロホルム (4 ml) 溶液にトリエチルアミン (302 mg, 2.99 mmol) を加え、次いで氷冷下で9-ブロモノナン酸クロリド (2.99 mmol) のクロロホルム (4 ml) 溶液をゆっくりと滴下し、室温で3時間攪拌した。反応混合物を水で希釈後、酢酸エチルで抽出し、有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して得た粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィー (シリカゲル 125 g, 展開溶媒: ヘキサン: 酢酸エチル = 3:1 \rightarrow 2:1) で精製して9-ブロモ-N-(4-メチル-2-メチルチオ-3-ピリジル) ノナンアミド 261 mg (収率 35 %) を無色粉末晶 (融点: 77 - 78°C) として得た。このアミド (114 mg, 0.31 mmol) と2-メルカプ

トベンゾオキサゾール (46 mg, 0.31 mmol) の DMF (5 ml) 溶液に 18-クラウン-6 (8 mg, 0.03 mmol) と炭酸カリウム (51 mg, 0.37 mmol) を加え、80℃で2時間攪拌した。反応混合物を水で希釈後、酢酸エチルで抽出し、有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して得た粗生成物を分取薄層クロマトグラフィー (展開溶媒; クロロホルム: メタノール = 20:1) で精製して目的化合物 89 mg (収率 66 %) を無色粉末晶として得た。

融点 : 91 - 92℃

I R (K B r) cm^{-1} : 3433, 3268, 2924,
1518, 1496.

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

1.36 - 1.53 (8H, m), 1.74 - 1.88 (4H, m), 2.21 (3H, s),
2.43 (2H, t, $J = 7.6$ Hz), 2.53 (3H, s), 3.32 (2H, t, $J = 7.3$ Hz)
6.63 (1H, br s), 6.90 (1H, d, $J = 5.1$ Hz),
7.22 - 7.30 (1H, m), 7.43 (1H, dd, $J = 7.2, 1.4$ Hz),
7.60 (1H, dd, $J = 7.6, 1.4$ Hz), 8.24 (1H, d, $J = 4.9$ Hz).

E I M S m/z (relative intensity): 443 (M^+ , 100).

元素分析 : $\text{C}_{23}\text{H}_{29}\text{N}_3\text{O}_2\text{S}_2$ として

計算値 : C, 62.27; H, 6.59; N, 9.47; S, 14.45.

実測値 : C, 62.34; H, 6.58; N, 9.33; S, 14.44.

実施例 8 (表中の化合物番号 168 の化合物)

9 - (ベンゾチアゾール-2-イルチオ) - N - (4-メチル-2-メチルチオ-3-ピリジル) ノナンアミドの製造:

2-メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに 2-メルカプトベンゾチアゾールを用いて実施例 7 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

融点 : 88 - 90℃

I R (K B r) cm^{-1} : 3449, 3271, 2925,
1657, 1425, 997.

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

1.37 - 1.53 (8H, m), 1.73 - 1.87 (4H, m), 2.21 (3H, s),
2.43 (2H, t, J = 7.6 Hz), 2.53 (3H, s), 3.35 (2H, t, J = 7.3 Hz),
6.62 (1H, br s), 6.90 (1H, d, J = 5.1 Hz),
7.23 - 7.31 (1H, m), 7.39 - 7.43 (1H, m),
7.75 (1H, dd, J = 8.1, 0.5 Hz), 7.86 (1H, dd, J = 8.1, 0.5 Hz),
8.24 (1H, d, J = 5.1 Hz).

元素分析 : $C_{23}H_{29}N_3OS_3$ として

計算値 : C, 60.10; H, 6.36; N, 9.14.

実測値 : C, 59.99; H, 6.36; N, 9.00.

実施例 9 (表中の化合物番号 275 の化合物)

6-(ベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,6-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル]ヘキサナムイドの製造:

2-クロロ-3-ニトロピリジンの代わりに2,6-ジクロロ-3-ニトロピリジンを用いて実施例1と同様に反応・処理し、2,6-ビス(メチルチオ)-3-ニトロピリジンを得た。このニトロピリジン(800 mg, 3.70 mmol)を酢酸(100 ml)と濃塩酸(5.6 ml)の混合溶媒に溶解し、氷冷下で亜鉛(2.90 g, 44.39 mmol)を少量ずつ加えた。30分間攪拌後、反応混合物を濾過し、濾液を炭酸水素ナトリウム水溶液で中和し、塩化メチレンで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して得た粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィー(展開溶媒; ヘキサン: 酢酸エチル = 4:1)で精製して、3-アミノ-2,6-ビス(メチルチオ)ピリジン 301 mg (収率 44%)を淡黄色粉末晶として得た。

このアミノピリジン(301 mg, 1.62 mmol)のTHF(3 ml)溶液にトリエチルアミン(196 mg, 1.94 mmol)を加え、次いで氷冷下で6-ブロモヘキサン酸クロリド(345 mg, 1.62 mmol)のTHF(1 ml)溶液をゆっくりと滴下し、0℃で3時間攪拌した。反応混合物を水で希釈後酢酸エチルで抽出し、有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を留去して得た粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィー(展開溶媒; ヘキサン: 酢酸エチル = 4:1)で

精製して 6-ブロモ-N-[2, 6-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル]ヘキサナムド 453 mg (収率 77 %) を無色粉末晶 (融点 : 117 - 119℃) として得た。このアミド (100 mg, 0.28 mmol) と 2-メルカプトベンゾオキサゾール (42 mg, 0.28 mmol) の DMF (4 ml) 溶液に 18-クラウン-6 (7 mg, 0.03 mmol) と炭酸カリウム (46 mg, 0.33 mmol) を加え、80℃で3時間攪拌した。反応混合物を水で希釈後、酢酸エチルで抽出し、有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を留去して得た粗生成物を酢酸エチル-ヘキサンより再結晶し、目的化合物 83 mg (収率 70 %) を無色粉末晶として得た。

融点 : 125 - 126℃

IR (KBr) cm^{-1} : 3436, 3253, 2937,
1653, 1519, 1505.

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

1.57 - 1.65 (2H, m), 1.78 - 1.86 (2H, m), 1.88 - 1.95 (2H, m),
2.44 (2H, t, $J = 7.4$ Hz), 2.57 (3H, s), 2.62 (3H, s),
3.33 (2H, t, $J = 7.3$ Hz), 6.93 (1H, d, $J = 8.4$ Hz),
7.02 (1H, br s), 7.21 - 7.30 (2H, m),
7.43 (1H, dd, $J = 7.4, 1.7$ Hz),
7.59 (1H, dd, $J = 7.4, 1.7$ Hz), 8.01 (1H, d, $J = 8.4$ Hz).

元素分析 : $\text{C}_{20}\text{H}_{23}\text{N}_3\text{O}_2\text{S}_3$ として

計算値 : C, 55.40; H, 5.35; N, 9.69.

実測値 : C, 55.53; H, 5.38; N, 9.68.

実施例 10 (表中の化合物番号 455 の化合物)

6-(ベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-(6-メチル-2-メチルチオ-3-ピリジル)ヘキサナムドの製造:

2-クロロ-3-ニトロピリジンの代わりに2-クロロ-6-メチル-3-ニトロピリジンを用いて実施例1と同様に反応・処理し、6-メチル-2-メチルチオ-3-ニトロピリジンを得た。このニトロピリジン (921 mg, 5.0 mmol) を酢酸 (40 ml) と濃塩酸 (1.75 ml) の混合溶媒に溶解し、氷冷下で亜鉛 (3.81 g,

60 mmol) を少量ずつ加えた。30 分間攪拌後、反応混合物を濾過し、濾液を炭酸水素ナトリウム水溶液で中和し、塩化メチレンで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して、3-アミノ-6-メチル-2-メチルチオピリジン 685 mg (収率 88 %) を黄色油状物として得た。

このアミノピリジン (601 mg, 3.9 mmol) のクロロホルム (10 ml) 溶液にトリエチルアミン (475 mg, 4.7 mmol) を加え、次いで氷冷下で 6-ブロモヘキサン酸クロリド (944 mg, 4.29 mmol) をゆっくりと滴下し、室温で 12 時間攪拌した。反応混合物を水で希釈後塩化メチレンで抽出し、有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して得た粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィー (シリカゲル 50 g, 展開溶媒; ヘキサン: 酢酸エチル = 10:1 → 5:1) で精製して 6-ブロモ-N-(6-メチル-2-メチルチオ-3-ピリジル)ヘキサンアミド 773 mg (収率 59 %) を無色結晶 (融点: 98 - 99℃) として得た。このアミド (133 mg, 0.4 mmol) と 2-メルカプトベンゾオキサゾール (67 mg, 0.44 mmol) の DMF (2 ml) 溶液に 18-クラウン-6 (11 mg, 0.04 mmol) と炭酸カリウム (67 mg, 0.44 mmol) を加え、80℃で 90 分間攪拌した。反応混合物を水で希釈後、酢酸エチルで抽出し、有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して得た粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィー (シリカゲル 20 g, 展開溶媒; ヘキサン: アセトン = 5:1 → 5:3) で精製して目的化合物 125 mg (収率 78 %) を無色針状晶として得た。

融点: 140 - 141℃

IR (KBr) cm^{-1} : 3437, 3267, 1654,
1528, 1506.

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

1.57 - 1.65 (2H, m), 1.82 (2H, quint, $J = 7.4$ Hz),
1.91 (2H, quint, $J = 7.4$ Hz), 2.44 (2H, t, $J = 7.4$ Hz),
2.48 (3H, s), 2.60 (3H, s), 3.33 (2H, t, $J = 7.4$ Hz),
6.90 (1H, d, $J = 8.1$ Hz), 7.21 - 7.30 (2H, m), 7.43 (1H, m),
7.59 (1H, m), 8.13 (1H, d, $J = 8.1$ Hz).

E I M S m/z (relative intensity): 401 (M^+), 203 (100).

元素分析 : $C_{20}H_{23}N_3O_2S_2$ として

計算値 : C, 59.82; H, 5.77; N, 10.46.

実測値 : C, 59.90; H, 5.84; N, 10.32.

実施例 11 (表中の化合物番号 458 の化合物)

9-(ベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-(6-メチル-2-メチルチオ-3-ピリジル)ノナンアミドの製造:

3-アミノ-6-メチル-2-メチルチオピリジン (685 mg, 4.44 mmol) のクロロホルム (10 ml) 溶液にトリエチルアミン (607 mg, 6.0 mmol) を加え、次いで氷冷下で 9-ブロモノナン酸クロリド (1281 mg, 5 mmol) のクロロホルム (3 ml) 溶液をゆっくりと滴下し、室温で 17 時間攪拌した。反応混合物を水で希釈後酢酸エチルで抽出し、有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して得た粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィー (シリカゲル 75g, 展開溶媒; ヘキサン: 酢酸エチル = 10:1 → 4:1) で精製して 9-ブロモ-N-(6-メチル-2-メチルチオ-3-ピリジル)ノナンアミド 433 mg (収率 27 %) を無色結晶 (融点: 80 - 82°C) として得た。

このアミド (131 mg, 0.35 mmol) と 2-メルカプトベンゾオキサゾール (58 mg, 0.385 mmol) の DMF (1.5 ml) 溶液に 18-クラウン-6 (9 mg, 0.035 mmol) と炭酸カリウム (58 mg, 0.42 mmol) を加え、80°C で 3 時間攪拌した。反応混合物を水で希釈後、酢酸エチルで抽出し、有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して得た粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィー (シリカゲル 30 g, 展開溶媒; ヘキサン: 酢酸エチル = 4:1 → 3:1) で精製して目的化合物 123 mg (収率 79 %) を無色針状晶として得た

融点 : 99 - 100°C

I R (KBr) cm^{-1} : 3421, 3235, 2924,
1655, 1528, 1497,
1455.

1H -NMR ($CDCl_3$) δ :

1.32-1.42 (6H, m), 1.43-1.51 (2H, m), 1.70-1.78 (2H, m),
1.83 (2H, quint, $J = 7.4$ Hz), 2.40 (2H, t, $J = 7.4$ Hz),
2.48 (3H, s), 2.61 (3H, s), 3.31 (2H, t, $J = 7.4$ Hz),
6.90 (1H, d, $J = 8.1$ Hz), 7.21-7.30 (3H, m), 7.43 (1H, m),
7.60 (1H, m), 8.15 (1H, d, $J = 8.1$ Hz).

EIMS m/z (relative intensity): 443 (M^+), 311 (100).

実施例 12 (表中の化合物番号 465 の化合物)

6 - (ベンゾチアゾール-2-イルチオ) - N - (6-メチル-2-メチルチオ-3-ピリジル) ヘキサナムイドの製造:

2-メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに 2-メルカプトベンゾチアゾールを用いて実施例 10 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 122 - 123 °C

IR (KBr) cm^{-1} : 3438, 3290, 1656,
1515, 1431.

1H -NMR ($CDCl_3$) δ :

1.57 - 1.65 (2H, m), 1.82 (2H, quint, $J = 7.4$ Hz),
1.90 (2H, quint, $J = 7.4$ Hz), 2.44 (2H, t, $J = 7.4$ Hz),
2.48 (3H, s), 2.60 (3H, s), 3.37 (2H, t, $J = 7.4$ Hz),
6.90 (1H, d, $J = 8.3$ Hz), 7.22 (1H, br s) 7.29 (1H, m),
7.41 (1H, m), 7.75 (1H, m), 7.86 (1H, m), 8.13 (1H, $J = 8.3$ Hz).

EIMS m/z (relative intensity): 417 (M^+), 168 (100).

元素分析 : $C_{20}H_{23}N_3OS_3$ として

計算値 : C, 57.52; H, 5.55; N, 10.06.

実測値 : C, 57.65; H, 5.63; N, 9.97.

実施例 13 (表中の化合物番号 468 の化合物)

9 - (ベンゾチアゾール-2-イルチオ) - N - (6-メチル-2-メチルチ

オー 3 -ピリジル) ノナンアミドの製造:

2-メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに 2-メルカプトベンゾチアゾールを用いて実施例 11 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 104-105℃

IR (KBr) cm^{-1} : 3280, 2924, 1662,
1527, 1428.

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

1.32-1.41 (6H, m), 1.43-1.51 (2H, m), 1.70-1.77 (2H, m),
1.82 (2H, quint, $J = 7.4 \text{ Hz}$), 2.40 (2H, t, $J = 7.4 \text{ Hz}$),
2.48 (3H, s), 2.61 (3H, s), 3.34 (2H, t, $J = 7.4 \text{ Hz}$),
6.90 (1H, d, $J = 8.1 \text{ Hz}$), 7.22 (1H, br s) 7.29 (1H, m),
7.41 (1H, m), 7.76 (1H, m), 7.86 (1H, m),
8.15 (1H, d, $J = 8.1 \text{ Hz}$).

EMS m/z (relative intensity): 459 (M^+), 293 (100).

元素分析 : $\text{C}_{23}\text{H}_{29}\text{N}_3\text{OS}_3$ として

計算値 : C, 60.10; H, 6.36; N, 9.14.

実測値 : C, 60.17; H, 6.40; N, 9.11.

実施例 14 (表中の化合物番号 475 の化合物)

6-(ベンズイミダゾール-2-イルチオ)-N-(6-メチル-2-メチルチオ-3-ピリジル)ヘキサンアミドの製造:

2-メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに 2-メルカプトベンズイミダゾールを用いて実施例 10 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色結晶として得た。

融点 : 138-140℃

IR (KBr) cm^{-1} : 3385, 3244, 1668,
1509, 1440.

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

1.53 - 1.61 (2H, m), 1.78 (2H, quint, $J = 7.6$ Hz),
1.82 (2H, quint, $J = 7.6$ Hz), 2.41 (2H, t, $J = 7.6$ Hz),
2.48 (3H, s), 2.59 (3H, s), 3.31 (2H, t, $J = 7.6$ Hz),
6.88 (1H, d, $J = 8.3$ Hz), 7.16 - 7.23 (2H, m), 7.31-7.32 (2H, m),
7.67 (1H, m), 8.08 (1H, d, $J = 8.3$ Hz), 9.72 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 400 (M^+), 164 (100).

元素分析 : $C_{20}H_{24}N_4OS_2$ として

計算値 : C, 59.97; H, 6.04; N, 13.99.

実測値 : C, 60.08; H, 6.08; N, 13.94.

実施例 15 (表中の化合物番号 478 の化合物)

9 - (ベンズイミダゾール - 2 - イルチオ) - N - (6 - メチル - 2 - メチルチオ - 3 - ピリジル) ノナンアミドの製造:

2 - メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに 2 - メルカプトベンズイミダゾールを用いて実施例 11 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 73 - 75 °C

I R (K B r) cm^{-1} : 3254, 2926, 1663,
1515, 1438.

1H -NMR (CDCl₃) δ :

1.27-1.43 (8H, m), 1.68-1.78 (4H, m), 2.40 (2H, t, $J = 7.4$ Hz),
2.48 (3H, s), 2.60 (3H, s), 3.31 (2H, t, $J = 7.4$ Hz),
6.89 (1H, d, $J = 8.1$ Hz), 7.17-7.20 (2H, m), 7.31-7.33 (2H, m),
7.67 (1H, m), 8.13 (1H, d, $J = 8.1$ Hz), 9.69 (1H, br s).

実施例 16 (表中の化合物番号 781 の化合物)

2 - (ベンゾオキサゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ビス (メチルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] アセトアミドの製造:

3 - アミノ - 2, 4 - ビス (メチルチオ) - 6 - メチルピリジン (492 mg, 2.

46 mmol) のクロロホルム (10 ml) 溶液にトリエチルアミン (274 mg, 2.71 mmol) を加え、次いで氷冷下でプロモ酢酸ブロミド (521 mg, 2.58 mmol) をゆっくりと滴下し、室温で2時間攪拌した。反応混合物を水で希釈後、塩化メチレンで抽出し、有機層を1N塩酸、水、炭酸水素ナトリウム水溶液、水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して得た粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィー (シリカゲル25 g, 展開溶媒; ヘキサン: アセトン = 7:1 → 5:1 → 3:1) で精製して2-ブロモ-N-[2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル] アセトアミド 100 mg (収率 13 %) を無色結晶 (融点: 171 - 172℃) として得た。

このアミド (96 mg, 0.3 mmol) と2-メルカプトベンゾオキサゾール (45 mg, 0.3 mmol) のアセトニトリル (5 ml) 溶液に炭酸カリウム (46 mg, 0.33 mmol) を加え、室温で90分間攪拌した。反応混合物を水で希釈後、酢酸エチルで抽出し、有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して得た粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィー (シリカゲル10 g, 展開溶媒; ヘキサン: アセトン = 5:2) で精製して目的化合物 88 mg (収率 75 %) を無色結晶として得た。

融点: 203 - 205℃

IR (KBr) cm^{-1} : 3437, 3238, 1669,
1509, 1454.

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

2.31 (3H, s), 2.41 (3H, s), 2.46 (3H, s), 4.10 (2H, s),
6.61 (1H, s), 7.28 - 7.33 (2H, m), 7.49 (1H, m), 7.60 (1H, m),
8.77 (1H, br s).

EMS m/z (relative intensity): 391 (M^+), 227 (100).

元素分析: $\text{C}_{17}\text{H}_{17}\text{N}_3\text{O}_2\text{S}_3$ として

計算値: C, 52.15; H, 4.38; N, 10.73.

実測値: C, 52.14; H, 4.44; N, 10.57.

実施例 17 (表中の化合物番号 783 の化合物)

4 - (ベンゾオキサゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ビス (メチルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] ブタンアミドの製造:

3 - アミノ - 2, 4 - ビス (メチルチオ) - 6 - メチルピリジン (341 mg, 1.70 mmol) の THF (6 ml) 溶液にトリエチルアミン (206 mg, 2.04 mmol) を加え、次いで氷冷下で 4 - ブロモブタン酸クロリド (379 mg, 2.04 mmol) をゆっくりと滴下し、室温で 2 時間攪拌した。反応混合物を水で希釈後酢酸エチルで抽出し、有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して得た粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィー (シリカゲル 75 g, 展開溶媒; ヘキサン: アセトン = 5:1 → 3:1) で精製して 4 - ブロモ - N - [2, 4 - ビス (メチルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] ブタンアミド 390 mg (収率 66%) を無色結晶 (融点: 139 - 140°C) として得た。

このアミド (105 mg, 0.3 mmol) と 2 - メルカプトベンゾオキサゾール (50 mg, 0.33 mmol) の DMF (2 ml) 溶液に 18 - クラウン - 6 (8 mg, 0.03 mmol) と炭酸カリウム (50 mg, 0.36 mmol) を加え、80°C で 3 時間攪拌した。反応混合物を水で希釈後、酢酸エチルで抽出し、有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して得た粗生成物を分取層クロマトグラフィー (展開溶媒; ヘキサン: 酢酸エチル = 3:2, 2 回展開) で精製して目的化合物 67 mg (収率 53%) を無色針状晶として得た。

融点: 149 - 150°C

IR (KBr) cm^{-1} : 3437, 3248, 1667, 1503, 1455.

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

2.13 (2H, quint, $J = 7.2$ Hz), 2.37 (3H, s), 2.38 (3H, s),
2.44 (3H, s), 2.49 (2H, t, $J = 7.2$ Hz), 3.43 (2H, t, $J = 7.2$ Hz),
6.88 (1H, s), 7.30 - 7.37 (2H, m), 7.64 - 7.68 (2H, m),
9.45 (1H, br s).

EMS m/z (relative intensity): 419 (M^+ , 100).

元素分析: $\text{C}_{19}\text{H}_{21}\text{N}_3\text{O}_2\text{S}_3$ として

計算値: C, 54.39; H, 5.04; N, 10.01.

実測値 : C, 54.58; H, 5.08; N, 9.98.

実施例 18 (表中の化合物番号 785 の化合物)

6-(ベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ヘキサンアミドの製造:

4-ブロモブタン酸クロリドの代わりに6-ブロモヘキサン酸クロリドを用いて実施例 17 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

融点 : 120-121℃

IR (KBr) cm^{-1} : 3433, 3235, 1662,
1502, 1455.

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.44 - 1.54 (2H, m), 1.58 - 1.68 (2H, m), 1.72 - 1.82 (2H, m),
2.18 - 2.27 (2H, m), 2.32 (3H, s), 2.34 (3H, s), 2.37 (3H, s),
3.27 (2H, t, $J = 7.2 \text{ Hz}$), 6.78 (1H, s), 7.19 - 7.26 (2H, m),
7.47 - 7.53 (2H, m), 8.74 (1H, br s).

EMS m/z (relative intensity): 446 (M^+-1), 200 (100).

元素分析 : $\text{C}_{21}\text{H}_{25}\text{N}_3\text{O}_2\text{S}_3$ として

計算値 : C, 56.35; H, 5.63; N, 9.39; S, 21.49.

実測値 : C, 56.42; H, 5.62; N, 9.26; S, 21.39.

実施例 19 (表中の化合物番号 788 の化合物)

9-(ベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ノナンアミドの製造:

4-ブロモブタン酸クロリドの代わりに9-ブロモノナン酸クロリドを用いて実施例 17 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

融点 : 123-124℃

IR (KBr) cm^{-1} : 3461, 3246, 1671,
1504, 1454.

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.26 - 1.46 (8H, m), 1.53 - 1.63 (2H, m), 1.72 - 1.83 (2H, m),
 2.24 (2H, t, $J = 7.3$ Hz), 2.37 (3H, s), 2.37 (3H, s),
 2.43 (3H, s), 3.31 - 3.41 (2H, m), 6.86 (1H, s),
 7.27 - 7.34 (2H, m), 7.58 - 7.66 (2H, m), 9.26 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 489 (M^+ , 100).

元素分析 : $C_{24}H_{31}N_3O_2S_3$ として

計算値 : C, 58.86; H, 6.38; N, 8.58; S, 19.64.

実測値 : C, 58.94; H, 6.37; N, 8.44; S, 19.55.

実施例 20 (表中の化合物番号 793 の化合物)

4 - (ベンゾチアゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ビス (メチルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] ブタンアミドの製造 :

2 - メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに 2 - メルカプトベンゾチアゾールを用いて実施例 17 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色結晶として得た。

融点 : 131 - 133 °C

IR (KBr) cm^{-1} : 3435, 3250, 1665,
 1509, 1428.

1H -NMR (d_6 -DMSO) δ :

2.11 (2H, quint, $J = 7.2$ Hz), 2.37 (3H, s), 2.38 (3H, s),
 2.44 (3H, s), 2.49 (2H, t, $J = 7.2$ Hz), 3.46 (2H, t, $J = 7.2$ Hz),
 6.88 (1H, s), 7.37 (1H, m), 7.47 (1H, m), 7.87 (1H, m),
 8.02 (1H, m), 9.45 (1H, s).

EIMS m/z (relative intensity): 435 (M^+), 168 (100).

元素分析 : $C_{19}H_{21}N_3OS_4$ として

計算値 : C, 52.39; H, 4.86; N, 9.65.

実測値 : C, 52.39; H, 4.84; N, 9.56.

実施例 21 (表中の化合物番号 795 の化合物)

6 - (ベンゾチアゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ビス (メチルチ

オ) -6-メチル-3-ピリジル] ヘキサナムイドの製造:

2-メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカプトベンゾチアゾールを用いて実施例18と同様に反応・処理し、目的化合物を淡黄色結晶として得た。

融点 : 123-125℃

IR (KBr) cm^{-1} : 3433, 3258, 2923,
1661, 1429

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.49 - 1.58 (6H, m), 1.67 (2H, quint, $J = 7.2$ Hz),
1.83 (2H, quint, $J = 7.2$ Hz), 2.29 (2H, t, $J = 7.2$ Hz),
2.38 (3H, s), 2.39 (3H, s), 2.45 (3H, s),
3.38 (2H, t, $J = 7.2$ Hz), 6.68 (1H, s),
7.36 (1H, td, $J = 8.0, 1.0$ Hz), 7.46 (1H, td, $J = 8.0, 1.0$ Hz),
7.86 (1H, dd, $J = 8.0, 1.0$ Hz), 8.01 (1H, br d, $J = 8.0$ Hz),
9.31 (1H, s).

EMS m/z (relative intensity): 463 (M^+), 201 (100).

元素分析 : $\text{C}_{21}\text{H}_{25}\text{N}_3\text{O}_2\text{S}_4$ として

計算値 : C, 54.40; H, 5.43; N, 9.06; S, 27.66.

実測値 : C, 54.42; H, 5.45; N, 8.79; S, 27.68.

実施例22 (表中の化合物番号798の化合物)

9-(ベンゾチアゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル] ノナンアミドの製造:

2-メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカプトベンゾチアゾールを用いて実施例19と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

融点 : 126-127℃

IR (KBr) cm^{-1} : 3440, 3252, 2924,
1661, 1430.

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.31 - 1.52 (8H, m), 1.59 - 1.68 (2H, m), 1.77 - 1.85 (2H, m),
 2.23 - 2.33 (2H, m), 2.40 (3H, s), 2.42 (3H, s), 2.45 (3H, s),
 3.36 (2H, t, $J = 7.2$ Hz), 6.86 (1H, s),
 7.34 (1H, dt, $J = 7.8, 1.2$ Hz),
 7.44 (1H, dt, $J = 7.8, 1.2$ Hz), 7.83 (1H, d, $J = 8.3$ Hz),
 7.93 (1H, dt, $J = 7.8, 0.6$ Hz), 8.78 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 504 (M^+-1), 200 (100).

元素分析 : $\text{C}_{24}\text{H}_{31}\text{N}_3\text{O}_5$ として

計算値 : C, 57.00; H, 6.18; N, 8.31; S, 25.36.

実測値 : C, 57.08; H, 6.17; N, 8.15; S, 25.41.

実施例 23 (表中の化合物番号 803 の化合物)

4 - (ベンズイミダゾール-2-イルチオ) - N - [2, 4-ビス(メチルチオ) - 6-メチル-3-ピリジル] ブタンアミドの製造 :

2-メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカプトベンズイミダゾールを用いて実施例 17 と同様に反応・処理し、目的化合物を淡黄色針状晶として得た。

融点 : 177 - 179 °C

IR (KBr) cm^{-1} : 3421, 3147, 1659,
 1645, 1438.

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

2.06 (2H, quint, $J = 7.2$ Hz), 2.38 (3H, s), 2.39 (3H, s),
 2.44 (3H, s), 2.46 (2H, t, $J = 7.2$ Hz), 3.36 (2H, t, $J = 7.2$ Hz),
 6.88 (1H, s), 7.09 - 7.13 (2H, m), 7.34 - 7.52 (2H, m),
 9.48 (1H, s), 12.54 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 418 (M^+), 150 (100).

実施例 24 (表中の化合物番号 805 の化合物)

6 - (ベンズイミダゾール-2-イルチオ) - N - [2, 4-ビス(メチルチオ) - 6-メチル-3-ピリジル] ヘキサナムイドの製造:

2-メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカプトベンズイミダゾールを用いて実施例18と同様に反応・処理し、目的化合物を無色結晶として得た。

融点 : 139 - 141 °C

IR (KBr) cm^{-1} : 3433, 3244, 2924,
1659, 1437.

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.47 - 1.56 (2H, m), 1.65 (2H, quint, $J = 7.2$ Hz),
1.76 (2H, quint, $J = 7.2$ Hz), 2.28 (2H, t, $J = 7.2$ Hz),
2.38 (3H, s), 2.39 (3H, s), 2.44 (3H, s),
3.29 (2H, t, $J = 7.2$ Hz), 6.68 (1H, s),
7.08 - 7.13 (2H, m), 7.36 (1H, m), 7.50 (1H, m), 9.30 (1H, s),
12.50 (1H, br s)

EIMS m/z (relative intensity): 446 (M^+), 200 (100).

実施例25 (表中の化合物番号808の化合物)

9 - (ベンズイミダゾール-2-イルチオ) - N - [2, 4-ビス(メチルチオ) - 6-メチル-3-ピリジル] ノナンアミドの製造:

2-メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカプトベンズイミダゾールを用いて実施例19と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

IR (KBr) cm^{-1} : 3146, 2925, 2854,
1660, 1523, 1437.

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.25 - 1.44 (8H, m), 1.53 - 1.61 (2H, m), 1.65 - 1.74 (2H, m),
2.24 (2H, t, $J = 7.3$ Hz), 2.37 (3H, s), 2.38 (3H, s),
2.43 (3H, s), 3.26 (2H, t, $J = 7.1$ Hz), 6.86 (1H, s),

7.07 - 7.12 (2H, m), 7.32 - 7.37 (1H, m), 7.46 - 7.54 (1H, m),
9.26 (1H, s).

E I M S m/z (relative intensity): 488 (M^+), 150 (100).

実施例 26 (表中の化合物番号 811 の化合物)

2-(ベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]アセトアミドの製造:

ナトリウムエトキシド (1.27 g, 25 mmol) のエタノール (50 ml) 溶液に、氷冷下でエタンチオール (1.55 g, 25 mmol) を滴下し 30 分間攪拌した。氷冷下のまま、2,4-ジクロロ-6-メチル-3-ニトロピリジン (2.1 g, 10 mmol) の DMF (40 ml) 溶液をゆっくりと滴下した。2 時間攪拌後、反応混合物を酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して、2,4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ニトロピリジン 2.45 g (収率 95 %) を黄色針状晶として得た。

このニトロピリジン (775 mg, 3 mmol) を酢酸 (30 ml) と濃塩酸 (1.5 ml) の混合溶媒に溶解し、氷冷下で亜鉛 (4 g, 60 mmol) を少量ずつ加えた。10 分間攪拌後、反応混合物を濾過し、濾液を水酸化ナトリウム水溶液で中和し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して、3-アミノ-2,4-ビス(エチルチオ)-6-メチルピリジン 590 mg (収率 86 %) を黄色油状物として得た。このアミノピリジン (590 mg, 2.6 mmol) の THF (10 ml) 溶液にトリエチルアミン (304 mg, 3 mmol) を加え、次いで氷冷下でプロモ酢酸ブロミド (606 mg, 3 mmol) をゆっくりと滴下し、室温で 1 時間攪拌した。反応混合物を濾過し濾液を濃縮した後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (シリカゲル 60 g、展開溶媒: ヘキサン: アセトン = 10:1 → 5:1) で精製して 2-ブロモ-N-[2,4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]アセトアミド 410 mg (収率 45 %) を薄褐色針状晶で得た。このアミド (105 mg, 0.3 mmol) と 2-メルカプトベンゾオキサゾール (45 mg, 0.3 mmol) のアセトニトリル (3 ml) 溶液に炭酸カリウム (46 mg, 0.33 mmol) を加え、室温で 2 時間攪拌した。反応混合物を酢酸エチルで抽

出し、有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して得た粗生成物を分取薄層クロマトグラフィー（展開溶媒；ヘキサン：酢酸エチル = 3：1）で精製して目的化合物 70 mg（収率 56 %）を無色針状晶として得た。

融点 : 143 - 145 °C

I R (K B r) cm^{-1} : 3429, 3224, 1673,
1509, 1454.

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

1.17 (3H, t, $J = 7.3 \text{ Hz}$), 1.20 (3H, t, $J = 7.5 \text{ Hz}$), 2.43 (3H, s),
2.81 (2H, q, $J = 7.3 \text{ Hz}$), 3.04 (2H, q, $J = 7.5 \text{ Hz}$), 4.11 (2H, s),
6.63 (1H, s), 7.25 - 7.33 (2H, m), 7.48 (1H, m), 7.61 (1H, m),
8.63 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 419 (M^+), 268 (100).

元素分析 : $\text{C}_{19}\text{H}_{21}\text{N}_3\text{O}_2\text{S}_3$ として

計算値 : C, 54.39; H, 5.04; N, 10.01.

実測値 : C, 54.39; H, 5.05; N, 10.00.

実施例 27（表中の化合物番号 815 の化合物）

6 - (ベンゾオキサゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ビス (エチルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] ヘキサンアミドの製造 :

ブロモ酢酸ブロミドの代わりに 6 - ブロモヘキサン酸クロリドを用いて実施例 26 と同様に反応・処理し、6 - ブロモ - N - [2, 4 - ビス (エチルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] ヘキサンアミドを得た。このアミド (122 mg, 0.3 mmol) と 2 - メルカプトベンゾオキサゾール (45 mg, 0.3 mmol) の DMF (2 ml) 溶液に炭酸カリウム (46 mg, 0.33 mmol)、18 - クラウン - 6 (8 mg, 0.03 mmol) を加え、80 °C で 1.5 時間攪拌した。反応混合物を放冷後、酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して得た残渣を分取薄層クロマトグラフィー（展開溶媒；ヘキサン：アセトン = 5：2）で精製し目的化合物 65 mg（収率 46 %）を薄褐色針状晶として得た。

融点 : 100 - 103 °C

IR (KBr) cm^{-1} : 3233, 2928, 1668,
1504, 1455.

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.26 (3H, t, $J = 7.3$ Hz), 1.27 (3H, t, $J = 7.3$ Hz), 1.58 (2H, m),
1.70 (2H, m), 1.85 (2H, m), 2.32 (2H, m), 2.43 (3H, s),
2.94 (2H, q, $J = 7.3$ Hz), 3.07 (2H, q, $J = 7.3$ Hz),
3.35 (2H, t, $J = 7.3$ Hz), 6.89 (1H, s), 7.26 - 7.34 (2H, m),
7.54 - 7.62 (2H, m), 8.77 (1H, br s).

EMS m/z (relative intensity): 475 (M^+ , 100).

元素分析 : $\text{C}_{23}\text{H}_{29}\text{N}_3\text{O}_2\text{S}_3$ として

計算値 : C, 58.08; H, 6.14; N, 8.83; S, 20.22.

実測値 : C, 58.07; H, 6.13; N, 8.66; S, 20.27.

実施例 28 (表中の化合物番号 818 の化合物)

9 - (ベンゾオキサゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ビス (エチルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] ノナンアミドの製造 :

6 - ブロモヘキサン酸クロリドの代わりに 9 - ブロモノナン酸クロリドを用いて実施例 27 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 84 - 87 °C

IR (KBr) cm^{-1} : 3252, 2923, 1665,
1501, 1455.

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.26 (3H, t, $J = 7.3$ Hz), 1.27 (3H, t, $J = 7.3$ Hz),
1.28 - 1.52 (8H, m), 1.63 (2H, m), 1.82 (2H, quint, $J = 7.2$ Hz),
2.26 (2H, m), 2.43 (3H, s), 2.94 (2H, q, $J = 7.3$ Hz),
3.07 (2H, q, $J = 7.3$ Hz), 3.34 (2H, t, $J = 7.2$ Hz),
6.88 (1H, s), 7.26 - 7.34 (2H, m),
7.54 - 7.62 (2H, m), 8.72 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 517 (M^+), 367 (100).

元素分析 : $C_{26}H_{35}N_3O_2S_3$ として

計算値 : C, 60.31; H, 6.81; N, 8.12.

実測値 : C, 60.52; H, 6.85; N, 7.85.

実施例 29 (表中の化合物番号 821 の化合物)

2-(ベンゾチアゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]アセトアミドの製造:

2-メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカプトベンゾチアゾールを用いて実施例 26 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 119-120°C

IR (KBr) cm^{-1} : 3453, 3254, 1672,
1510, 1428.

1H -NMR (CDCl₃) δ :

1.20 (3H, t, $J = 7.4$ Hz), 1.22 (3H, t, $J = 7.4$ Hz), 2.42 (3H, s),
2.82 (2H, q, $J = 7.4$ Hz), 3.06 (2H, q, $J = 7.4$ Hz), 4.18 (2H, s),
6.63 (1H, s), 7.33 (1H, m), 7.42 (1H, m), 7.77 (1H, m),
7.91 (1H, m), 8.95 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 435 (M^+), 148 (100).

元素分析 : $C_{19}H_{21}N_3OS_4$ として

計算値 : C, 52.39; H, 4.86; N, 9.65.

実測値 : C, 52.40; H, 4.86; N, 9.53.

実施例 30 (表中の化合物番号 825 の化合物)

6-(ベンゾチアゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ヘキサンアミドの製造:

2-メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカプトベンゾチアゾールを用いて実施例 27 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得

た。

融点 : 81 - 83 °C

IR (KBr) cm^{-1} : 3150, 2927, 1647,
1524, 1428.

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.25 (3H, t, $J = 7.3 \text{ Hz}$), 1.26 (3H, t, $J = 7.3 \text{ Hz}$), 1.57 (2H, m),
1.69 (2H, m), 1.84 (2H, m), 2.29 (2H, m), 2.42 (3H, s),
2.93 (2H, q, $J = 7.3 \text{ Hz}$), 3.05 (2H, q, $J = 7.3 \text{ Hz}$),
3.36 (2H, t, $J = 7.3 \text{ Hz}$), 6.87 (1H, s), 7.33 (1H, m),
7.43 (1H, m), 7.82 (1H, m), 7.92 (1H, m), 8.77 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 491 (M^+), 168 (100).

元素分析 : $\text{C}_{23}\text{H}_{29}\text{N}_3\text{O}_4\text{S}_4$ として

計算値 : C, 56.18; H, 5.94; N, 8.55; S, 26.08.

実測値 : C, 56.19; H, 5.91; N, 8.43; S, 26.06.

実施例 31 (表中の化合物番号 828 の化合物)

9 - (ベンゾチアゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ビス (エチルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] ノナンアミドの製造 :

2 - メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに 2 - メルカプトベンゾチアゾールを用いて実施例 28 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 88 - 92 °C

IR (KBr) cm^{-1} : 3433, 3241, 2928,
1668, 1510.

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.25 (3H, t, $J = 7.3 \text{ Hz}$), 1.26 (3H, t, $J = 7.3 \text{ Hz}$),
1.28 - 1.54 (8H, m), 1.62 (2H, m), 1.80 (2H, quint, $J = 7.2 \text{ Hz}$),
2.24 (2H, m), 2.42 (3H, s), 2.93 (2H, q, $J = 7.3 \text{ Hz}$),
3.05 (2H, q, $J = 7.3 \text{ Hz}$), 3.35 (2H, t, $J = 7.2 \text{ Hz}$),

6.87 (1H, s), 7.33 (1H, m), 7.43 (1H, m), 7.81 (1H, m),
7.92 (1H, m), 8.72 (1H, br s).

実施例 3 2 (表中の化合物番号 8 3 1 の化合物)

2-(ベンズイミダゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]アセトアミド

2-メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカプトベンズイミダゾールを用いて実施例 2 6 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 182-183℃

IR (KBr) cm^{-1} : 3148, 2928, 1674,
1524, 1412.

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.21 (3H, t, $J = 7.3 \text{ Hz}$), 1.22 (3H, t, $J = 7.3 \text{ Hz}$), 2.41 (3H, s),
2.90 (2H, q, $J = 7.3 \text{ Hz}$), 3.03 (2H, q, $J = 7.3 \text{ Hz}$),
4.15 (2H, br s), 6.87 (1H, s), 7.08 - 7.12 (2H, m),
7.39 - 7.44 (2H, m).

EMS m/z (relative intensity): 418 (M^+), 357 (100).

元素分析 : $\text{C}_{19}\text{H}_{22}\text{N}_4\text{O}_3\text{S}_3$ として

計算値 : C 54.52; H, 5.30; N, 13.38.

実測値 : C, 54.44; H, 5.30; N, 13.16.

実施例 3 3 (表中の化合物番号 8 3 5 の化合物)

6-(ベンズイミダゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ヘキサナムドの製造:

2-メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカプトベンズイミダゾールを用いて実施例 2 7 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 139-142℃

I R (K B r) cm^{-1} : 3 4 3 3, 3 1 4 3, 2 9 2 8,
1 6 6 0, 1 5 1 0.

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.25 (3H, t, $J = 7.3 \text{ Hz}$), 1.26 (3H, t, $J = 7.3 \text{ Hz}$), 1.54 (2H, m),
1.68 (2H, m), 1.77 (2H, m), 2.28 (2H, m), 2.42 (3H, s),
2.92 (2H, q, $J = 7.3 \text{ Hz}$), 3.05 (2H, q, $J = 7.3 \text{ Hz}$),
3.27 (2H, t, $J = 7.2 \text{ Hz}$), 6.87 (1H, s), 7.05 - 7.11 (2H, m),
7.27 - 7.52 (2H, m), 8.75 (1H, br s), 12.05 (1H, br s).

実施例 3 4 (表中の化合物番号 8 3 8 の化合物)

9 - (ベンズイミダゾール-2-イルチオ) - N - [2, 4-ビス (エチルチオ) - 6-メチル-3-ピリジル] ノナンアミドの製造:

2-メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカプトベンズイミダゾールを用いて実施例 2 8 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 7 6 - 7 8 $^{\circ}\text{C}$

I R (K B r) cm^{-1} : 3 1 0 4, 2 9 2 8, 2 8 5 4,
1 6 5 8, 1 5 2 6.

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.25 (3H, t, $J = 7.3 \text{ Hz}$), 1.26 (3H, t, $J = 7.3 \text{ Hz}$),
1.28 - 1.49 (8H, m), 1.61 (2H, m), 1.73 (2H, quint, $J = 7.2 \text{ Hz}$),
2.24 (2H, m), 2.42 (3H, s), 2.92 (2H, q, $J = 7.3 \text{ Hz}$),
3.05 (2H, q, $J = 7.3 \text{ Hz}$), 3.26 (2H, t, $J = 7.2 \text{ Hz}$), 6.87 (1H, s),
7.05 - 7.10 (2H, m), 7.24 - 7.54 (2H, m), 8.71 (1H, br s),
12.05 (1H, br s).

実施例 3 5 (表中の化合物番号 8 4 1 の化合物)

2 - (ベンゾオキサゾール-2-イルチオ) - N - [2, 4-ビス (イソプロピルチオ) - 6-メチル-3-ピリジル] アセトアミドの製造:

ナトリウムイソプロポキシド (2.05 g, 25 mmol) の 2-プロパノール (50 ml) 溶液に、氷冷下で 2-プロパンチオール (1.90 g, 25 mmol) を滴下し 30 分間攪拌した。氷冷下のまま 2, 4-ジクロロ-6-メチル-3-ニトロピリジン (2.07 g, 10 mmol) の DMF (40 ml) 溶液をゆっくりと滴下した。2 時間攪拌後、反応混合物を酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して、2, 4-ビス (イソプロピルチオ) -6-メチル-3-ニトロピリジン 2.77 g (収率 97 %) を黄色針状晶として得た。

このニトロピリジン (1.08 g, 3.77 mmol) を酢酸 (35 ml) と濃塩酸 (1.6 ml) の混合溶媒に溶解し、氷冷下で亜鉛 (2.96 g, 45.25 mmol) を少量ずつ加えた。1 時間攪拌後、反応混合物を濾過し、濾液を炭酸水素ナトリウム水溶液で中和し、クロロホルムで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒; ヘキサン: 酢酸エチル = 30:1 → 10:1) で精製して 3-アミノ-2, 4-ビス (イソプロピルチオ) -6-メチルピリジン 774 mg (収率 80 %) を黄色油状物として得た。このアミノピリジン (774 mg, 3.02 mmol) の THF (10 ml) 溶液にトリエチルアミン (336 mg, 3.32 mmol) を加え、次いで氷冷下でプロモ酢酸ブロミド (732 mg, 3.62 mmol) をゆっくりと滴下し、17 時間攪拌した。反応混合物を濾過し濾液を濃縮した後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒; ヘキサン: 酢酸エチル = 10:1) で精製して 2-ブロモ-N-[2, 4-ビス (イソプロピルチオ) -6-メチル-3-ピリジル] アセトアミド 595 mg (収率 52 %) を無色粉末晶で得た。このアミド (132 mg, 0.35 mmol) と 2-メルカプトベンゾオキサゾール (53 mg, 0.35 mmol) のアセトニトリル (5 ml) 溶液に炭酸水素ナトリウム (29 mg, 0.35 mmol) を加え、室温で 28 時間攪拌した。反応混合物を酢酸エチルで抽出し、有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、酢酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して得た粗生成物を分取薄層クロマトグラフィー (展開溶媒; ヘキサン: ベンゼン = 6:1) で精製して目的化合物 69 mg (収率 44 %) を無色粉末晶として得た。

融点 : 99 - 101 °C

IR (KBr) cm^{-1} : 3437, 3241, 2967, 1659,

1 5 6 0, 1 5 0 2, 1 4 5 4.

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ :

1.19 (12H, d, $J=6.8$ Hz), 2.42 (3H, s),
 3.39 (1H, sept, $J = 6.8$ Hz),
 4.10 (2H, s), 6.68 (1H, s), 7.26 - 7.32 (2H, m), 7.48 (1H, m)
 7.61 (1H, m), 8.53 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity) : 447(M^+ , 100).

実施例 36 (表中の化合物番号 845 の化合物)

6-(ベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(イソプロピルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ヘキサナムドの製造:

ブロモ酢酸ブロミドの代わりに6-ブロモヘキサナムドクロリドを用いて実施例 35と同様に反応・処理し、6-ブロモ-N-[2,4-ビス(イソプロピルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ヘキサナムドを得た。このアミド (100 mg, 0.23 mmol) と2-メルカプトベンゾオキサゾール (35 mg, 0.23 mmol) のDMF (4 ml) 溶液に炭酸カリウム (38 mg, 0.28 mmol)、18-クラウン-6 (6 mg, 0.02 mmol) を加え、80℃で2.5時間攪拌した。反応混合物を放冷後、酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して得た残渣を分取薄層クロマトグラフィー (展開溶媒; ヘキサン; 酢酸エチル = 3:1) で精製し目的化合物 92 mg (収率 79%) を無色粉末晶として得た。

融点 : 98 - 100℃

IR (KBr) cm^{-1} : 3135, 2961, 1648,
 1498, 1454, 1133.

 $^1\text{H-NMR}$ (d₆-DMSO) δ :

1.32 (6H, d, $J = 6.8$ Hz), 1.35 (6H, d, $J = 6.8$ Hz),
 1.55 - 1.64 (2H, m), 1.65 - 1.75 (2H, m), 1.82 - 1.92 (2H, m),
 2.23 - 2.36 (2H, m), 2.46 (3H, s), 3.38 (2H, t, $J = 7.1$ Hz).

3.59 (1H, sept, $J = 6.8$ Hz), 3.93 (1H, sept, $J = 6.8$ Hz),
 6.96 (1H, s), 7.29 - 7.37 (2H, m), 7.57 - 7.64 (2H, m),
 8.95 (1H, br s).

実施例 37 (表中の化合物番号 1237 の化合物)

6-(オキサゾロ[4,5-b]ピリジン-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ヘキサンアミドの製造:

6-ブロモ-N-[2,4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ヘキサンアミド (100 mg, 0.27 mmol) と 2-メルカプトオキサゾロ[4,5-b]ピリジン (40 mg, 0.27 mmol) の DMF (4 ml) 溶液に 18-クラウン-6 (7 mg, 0.03 mmol) と炭酸カリウム (40 mg, 0.29 mmol) を加え、80℃で4時間攪拌した。反応混合物を水で希釈後、酢酸エチルで抽出し、有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を留去して得た粗生成物を分取薄層クロマトグラフィー (展開溶媒; ヘキサン: アセトン = 2:1) で精製して目的化合物 85 mg (収率 72%) を無色粉末晶として得た。

融点 : 132 - 133℃

IR (KBr) cm^{-1} : 3435, 3243, 2923, 1655,
 1493, 1404.

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.53-1.63 (2H, m), 1.65-1.76 (2H, m), 1.83-1.93 (2H, m),
 2.27-2.35 (2H, m), 2.40 (3H, s), 2.42 (3H, s), 2.45 (3H, s),
 3.40 (2H, t, $J=7.3$ Hz), 6.86 (1H, s),
 7.30 (1H, dd, $J=8.1, 4.9$ Hz), 7.97 (1H, dd, $J=8.1, 1.3$ Hz),
 8.42 (1H, dd, $J=4.9, 1.3$ Hz), 8.83 (1H, br s).

ESI MS m/z (relative intensity) : 447 (M^+-1), 400 (100).

元素分析 : $\text{C}_{20}\text{H}_{24}\text{N}_4\text{O}_2\text{S}_3$ として

計算値 : C, 53.55; H, 5.39; N, 12.59; S, 21.44.

実測値 : C, 53.72; H, 5.39; N, 12.41; S, 21.51.

実施例 38 (表中の化合物番号 1238 の化合物)

6-(7-メトキシカルボニルベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ヘキサンアミドの製造:

2-メルカプトオキサゾロ[4,5-b]ピリジンの代わりに7-メトキシカルボニル-2-メルカプトベンゾオキサゾールを用いて実施例37と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

融点 : 141-142℃

IR (KBr) cm^{-1} : 3425, 3236, 2923, 1726, 1667, 1509.

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.54-1.63 (2H, m), 1.67-1.76 (2H, m), 1.84-1.93 (2H, m),
2.28-2.35 (2H, m), 2.40 (3H, s), 2.42 (3H, s), 2.45 (3H, s),
3.39 (2H, t, $J=7.1\text{Hz}$), 3.95 (3H, s), 6.86 (1H, s),
7.44 (1H, t, $J=7.8\text{Hz}$), 7.81 (1H, dd, $J=7.8, 1.2\text{Hz}$),
7.85 (1H, dd, $J=7.8, 1.2\text{Hz}$), 8.82 (1H, br s).

ESI MS m/z (relative intensity) : 504(M^+-1), 167(100).

元素分析 : $\text{C}_{23}\text{H}_{27}\text{N}_3\text{O}_4\text{S}_3$ として

計算値 : C, 54.63; H, 5.38; N, 8.31; S, 19.02.

実測値 : C, 54.70; H, 5.37; N, 8.27; S, 19.15.

実施例 39 (表中の化合物番号 1240 の化合物)

9-(7-メトキシカルボニルベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ノナンアミドの製造:

9-ブロモ-N-[2,4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ノナンアミド (90 mg, 0.22 mmol) と 7-メトキシカルボニル-2-メルカプトベンゾオキサゾール (45 mg, 0.22 mmol) の DMF (4 ml) 溶液に 18-クラウン-6 (6 mg, 0.02 mmol) と炭酸カリウム (36 mg, 0.26 mmol) を加え、8

0℃で4時間攪拌した。反応混合物を水で希釈後、酢酸エチルで抽出し、有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を留去して得た粗生成物を酢酸エチル-ヘキサンより再結晶し、目的化合物 84 mg (収率 72 %) を無色粉末晶として得た。

融点 : 126-128℃

IR (KBr) cm^{-1} : 3231, 2924, 1720,
1657, 1508, 1297.

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.27-1.47 (8H, m), 1.54-1.62 (2H, m), 1.74-1.85 (2H, m),
2.24 (2H, t, $J=7.3\text{Hz}$), 2.37 (3H, s), 2.38 (3H, s), 2.43 (3H, s),
3.31-3.41 (2H, m), 3.91 (3H, s), 6.86 (1H, s),
7.45 (1H, t, $J=7.8\text{Hz}$), 7.81 (1H, dd, $J=7.8, 1.0\text{Hz}$),
7.91 (1H, dd, $J=7.8, 1.0\text{Hz}$), 9.26 (1H, s).

EMS m/z (relative intensity) : 546 (M^+-1), 500 (100).

元素分析 : $\text{C}_{26}\text{H}_{33}\text{N}_3\text{O}_4\text{S}_3$ として

計算値 : C, 57.01; H, 6.07; N, 7.67; S, 17.56.

実測値 : C, 57.10; H, 5.95; N, 7.67; S, 17.60.

実施例 40 (表中の化合物番号 151 の化合物)

2-(ベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-(4-メチル-2-メチルチオ-3-ピリジル)アセトアミドの製造:

3-アミノ-2,4-ビス(メチルチオ)-6-メチルピリジンの代わりに3-アミノ-4-メチル-2-メチルチオピリジンを用いて実施例 16 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 146-148℃

IR (KBr) cm^{-1} : 3437, 3245, 1671, 1659,
1507, 1454.

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

2.17 (3H, s), 2.42 (3H, s), 4.11 (2H, s).

6.87 (1H, d, $J = 4.9$ Hz),

7.28 - 7.34 (2H, m), 7.50 (1H, m), 7.61 (1H, m),

8.23 (1H, d, $J = 4.9$ Hz), 8.88 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 345 (M^+ , 100).

元素分析 : $C_{16}H_{15}N_3O_2S_2$ として

計算値 : C, 55.63; H, 4.38; N, 12.16; S, 18.56...

実測値 : C, 55.66; H, 4.46; N, 12.02; S, 18.55.

実施例 4 1 (表中の化合物番号 1 5 5 の化合物)

6 - (ベンゾオキサゾール - 2 - イルチオ) - N - (4 - メチル - 2 - メチルチオ - 3 - ピリジル) ヘキサナムイドの製造 :

3 - アミノ - 2, 4 - ビス (メチルチオ) - 6 - メチルピリジンの代わりに 3 - アミノ - 4 - メチル - 2 - メチルチオピリジンを用いて実施例 1 8 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 122 - 124 °C

IR (KBr) cm^{-1} : 3437, 3245, 1660, 1521,
1507, 1133.

1H -NMR (d_6 -DMSO) δ :

1.49 - 1.56 (2H, m), 1.68 (2H, quint, $J = 7.4$ Hz),

1.84 (2H, quint, $J = 7.4$ Hz), 2.09 (3H, s),

2.33 (2H, t, $J = 7.4$ Hz), 2.40 (3H, s), 3.36 (2H, t, $J = 7.4$ Hz),

7.02 (1H, d, $J = 4.9$ Hz), 7.29 - 7.36 (2H, m), 7.61 - 7.66 (2H, m),

8.24 (1H, d, $J = 4.9$ Hz), 9.40 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 401 (M^+ , 100).

元素分析 : $C_{20}H_{23}N_3O_2S_2$ として

計算値 : C, 59.82; H, 5.77; N, 10.46; S, 15.97.

実測値 : C, 59.93; H, 5.89; N, 10.34; S, 15.99.

実施例 4 2 (表中化合物番号 3 6 5 の化合物)

6 - (ベンゾオキサゾール - 2 - イルチオ) - N - (6 - メトキシ - 2 - メチルチオ - 3 - ピリジル) ヘキサンアミドの製造:

ナトリウムチオメトキシド (805 mg, 10.9 mmol) のメタノール溶液 (20 ml) に、氷冷下で 2 - クロロ - 6 - メトキシ - 3 - ニトロピリジン (2.0 g, 10.4 mmol) のメタノール溶液 (100 ml) を滴下し、室温に昇温して 17 時間攪拌後、析出した結晶を濾取して、6 - メトキシ - 2 - メチルチオ - 3 - ニトロピリジン 1.26 g (収率 59 %) を黄色粉末晶として得た。

このニトロピリジン (400 mg, 2.0 mmol) を酢酸 (20 ml) と濃塩酸 (0.5 ml) の混合溶媒に懸濁し、氷冷下で亜鉛 (1.57 g, 24.0 mmol) を少量ずつ加えた。氷冷下で 5 分間攪拌し、室温で 4.0 分間攪拌後反応混合物を濾過し、濾液を炭酸水素ナトリウム水溶液で中和し、塩化メチレンで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して得られた粗生成物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒; ヘキサン: 酢酸エチル = 6:1 → 4:1) で精製して、3 - アミノ - 6 - メトキシ - 2 - メチルチオピリジン 264 mg (収率 78 %) を淡褐色粉末晶として得た。

3 - アミノ - 2, 4 - ビス (メチルチオ) - 6 - メチルピリジンの代わりに 3 - アミノ - 6 - メトキシ - 2 - メチルチオピリジンを用いて実施例 18 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

融点 : 102 - 104 °C

IR (KBr) cm^{-1} : 3430, 3224, 2940, 1652, 1591.

^1H -NMR (CDCl_3) δ :

1.61 (2H, quint, $J = 7.4$ Hz), 1.82 (2H, quint, $J = 7.4$ Hz),
1.92 (2H, quint, $J = 7.4$ Hz), 2.42 (2H, t, $J = 7.4$ Hz),
2.59 (3H, s), 3.34 (2H, t, $J = 7.4$ Hz), 3.94 (3H, s),
6.47 (1H, d, $J = 8.5$ Hz), 6.91 (1H, br s),
7.23 (1H, td, $J = 7.7, 1.5$ Hz), 7.27 (1H, td, $J = 7.7, 1.5$ Hz),
7.43 (1H, dd, $J = 7.7, 1.5$ Hz), 7.58 (1H, dd, $J = 7.7, 1.5$ Hz),
7.93 (1H, d, $J = 8.5$ Hz).

EIMS m/z (relative intensity): 417 (M^+), 171 (100).

実施例 4 3 (表中の化合物番号 4 5 1 の化合物)

2 - (ベンゾオキサゾール - 2 - イルチオ) - N - (6 - メチル - 2 - メチルチオ - 3 - ピリジル) アセトアミドの製造:

3 - アミノ - 2, 4 - ビス (メチルチオ) - 6 - メチルピリジンの代わりに 3 - アミノ - 6 - メチル - 2 - メチルチオピリジンを用いて実施例 1 6 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 180 - 181 °C

IR (KBr) cm^{-1} : 3437, 3254, 1661, 1534,
1509, 1135.

1H -NMR (CDCl₃) δ :

2.46 (3H, s), 2.50 (3H, s), 4.10 (2H, s), 6.87 (2H, d, $J = 8.1$ Hz),
7.26 - 7.34 (2H, m), 7.48 (1H, m), 7.62 (1H, m),
8.12 (2H, d, $J = 8.1$ Hz), 9.27 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 345 (M^+), 298 (100).

元素分析: C₁₆H₁₆N₃O₂S₂として

計算値: C, 55.63; H, 4.38; N, 12.16; S, 18.56.

実測値: C, 55.62; H, 4.40; N, 12.10; S, 18.50.

実施例 4 4 (表中の化合物番号 4 6 1 の化合物)

2 - (ベンゾチアゾール - 2 - イルチオ) - N - (6 - メチル - 2 - メチルチオ - 3 - ピリジル) アセトアミドの製造:

2 - メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに 2 - メルカプトベンゾチアゾールを用いて実施例 4 3 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 175 - 176 °C

IR (KBr) cm^{-1} : 3437, 3248, 1656, 1532,
1430.

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

2.45 (3H, s), 2.47 (3H, s), 4.18 (2H, s), 6.87 (1H, d, $J = 8.1$ Hz),
7.34 (1H, m), 7.44 (1H, m), 7.77 (1H, m), 8.01 (1H, m),
8.07 (1H, d, $J = 8.1$ Hz), 9.31 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 361 (M^+), 210 (100).

元素分析 : $\text{C}_{16}\text{H}_{15}\text{N}_3\text{O}_2\text{S}_2$ として

計算値 : C, 53.16; H, 4.18; N, 11.62; S, 26.61.

実測値 : C, 53.23; H, 4.25; N, 11.55; S, 26.67.

実施例 45 (表中の化合物番号 471 の化合物)

2-(ベンズイミダゾール-2-イルチオ)-N-(6-メチル-2-メチルチオ-3-ピリジル)アセトアミドの製造:

2-メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカプトベンズイミダゾールを用いて実施例 43 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 192-193°C (d.)

IR (KBr) cm^{-1} : 3420, 3249, 1667, 1550,
1438, 744.

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

2.45 (3H, s), 2.50 (3H, s), 4.08 (2H, s), 6.84 (1H, d, $J = 8.1$ Hz),
7.19 - 7.25 (2H, m), 7.35 (1H, m), 7.73 (1H, m),
8.00 (1H, d, $J = 8.1$ Hz), 9.95 (1H, br s), 10.00 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 344 (M^+), 118 (100).

元素分析 : $\text{C}_{16}\text{H}_{16}\text{N}_4\text{O}_2\text{S}_2$ として

計算値 : C, 55.79; H, 4.68; N, 16.27; S, 18.62.

実測値 : C, 55.80; H, 4.68; N, 16.16; S, 18.65.

実施例 46 (表中の化合物番号 784 の化合物)

5-(ベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(メチルチ

オ) -6-メチル-3-ピリジル] ペンタンアミドの製造:

4-ブロモブタン酸クロリドの代わりに5-ブロモペンタン酸クロリドを用いて実施例17と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 147 - 150 °C

IR (KBr) cm^{-1} : 3230, 1664, 1501, 1455,
1136.

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.72 - 1.96 (4H, m), 2.36 (3H, s), 2.26 - 2.42 (2H, m),
2.39 (3H, s), 2.43 (3H, s), 3.36 (2H, t, $J = 7.2 \text{ Hz}$), 6.83 (1H, s),
7.23 - 7.33 (2H, m), 7.52 - 7.59 (2H, m), 8.74 (1H, br s).

EMS m/z (relative intensity): 433 (M^+), 201 (100).

実施例47 (表中の化合物番号786の化合物)

7-(ベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル] ヘプタンアミドの製造:

4-ブロモブタン酸クロリドの代わりに7-ブロモヘプタン酸クロリドを用いて実施例17と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

融点 : 137 - 139 °C

IR (KBr) cm^{-1} : 3437, 3242, 2922, 2857,
1660, 1500, 1455, 1132.

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.41 - 1.54 (4H, m), 1.60 - 1.70 (2H, m),
1.81 (2H, quint, $J = 7.1 \text{ Hz}$), 2.26 - 2.32 (2H, m), 2.38 (3H, s),
2.40 (3H, s), 2.43 (3H, s), 3.33 (2H, t, $J = 7.1 \text{ Hz}$),
6.81 (1H, s), 7.27 (1H, td, $J = 7.6, 1.7 \text{ Hz}$),
7.30 (1H, td, $J = 7.6, 1.7 \text{ Hz}$), 7.54 - 7.60 (2H, m),
8.79 (1H, br s).

EMS m/z (relative intensity): 461 (M^+), 200 (100).

実施例 48 (表中の化合物番号 787 の化合物)

8-(ベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]オクタンアミドの製造:

4-ブロモブタン酸クロリドの代わりに8-ブロモオクタン酸クロリドを用いて実施例 17 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色プリズム晶として得た。

融点 : 119-122℃

IR (KBr) cm^{-1} : 3435, 3248, 2923, 2856,
1660, 1501, 1454, 1131.

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.33 - 1.52 (6H, m), 1.58 - 1.69 (2H, m),
1.81 (2H, quint, $J = 7.1$ Hz), 2.26 - 2.32 (2H, m), 2.38 (3H, s),
2.41 (3H, s), 2.44 (3H, s), 3.33 (2H, t, $J = 7.1$ Hz),
6.84 (1H, s), 7.27 (1H, td, $J = 7.6, 1.7$ Hz),
7.30 (1H, td, $J = 7.6, 1.7$ Hz), 7.54 - 7.60 (2H, m),
8.77 (1H, br s).

EMS m/z (relative intensity): 475 (M^+), 200 (100).

実施例 49 (表中の化合物番号 791 の化合物)

2-(ベンゾチアゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]アセトアミドの製造:

炭酸水素ナトリウム (17 mg, 0.2 mmol) と 2-メルカプトベンゾチアゾール (34 mg, 0.2 mmol) のアセトニトリル溶液 (1 ml) に 2-ブロモ-N-[2,4-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル]アセトアミド (64 mg, 0.2 mmol) のアセトニトリル溶液 (6 ml) を加え、室温で48時間攪拌した。反応混合液を減圧濃縮し、この残渣を水で希釈後、酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して得られた粗生成物を、分取薄層クロマトグラフィー (展開溶媒; クロロホルム: メタノール = 200:1) で精製して、目的化合物 46 mg (収率 33%) を無色針状晶として得た。

融点 : 178-179℃

IR (KBr) cm^{-1} : 3437, 3246, 1665, 1564,
1497, 1430.

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

2.33 (3H, s), 2.44 (3H, s), 2.46 (3H, s), 4.17 (2H, s),
6.61 (1H, s), 7.33 (1H, m), 7.43 (1H, m), 7.78 (1H, m),
7.90 (1H, m), 9.11 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 407 (M^+), 209 (100).

元素分析: $\text{C}_{17}\text{H}_{17}\text{N}_3\text{O}_5$ として

計算値: C, 50.10; H, 4.20; N, 10.31; S, 31.46.

実測値: C, 50.18; H, 4.29; N, 10.23; S, 31.49.

実施例 50 (表中の化合物番号 794 の化合物)

5 - (ベンゾチアゾール-2-イルチオ) - N - [2, 4-ビス(メチルチオ) - 6-メチル-3-ピリジル] ペンタンアミドの製造:

2-メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカプトベンゾチアゾールを用いて実施例 46 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色結晶として得た。

融点: 121 - 123 $^{\circ}\text{C}$

IR (KBr) cm^{-1} : 3437, 3240, 2923, 1664,
1515, 1456, 1428, 995.

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.78 - 1.87 (2H, m), 1.88 - 1.96 (2H, m), 2.30 - 2.40 (2H, m),
2.38 (3H, s), 2.41 (3H, s), 2.45 (3H, s), 3.41 (2H, t, $J = 7.1$ Hz),
6.85 (1H, s), 7.34 (1H, t, $J = 7.6$ Hz), 7.45 (1H, t, $J = 7.6$ Hz),
7.84 (1H, d, $J = 7.6$ Hz), 7.94 (1H, d, $J = 7.6$ Hz),
8.87 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 449 (M^+), 201 (100).

実施例 51 (表中の化合物番号 796 の化合物)

7 - (ベンゾチアゾール-2-イルチオ) - N - [2, 4-ビス(メチルチ

オ) -6-メチル-3-ピリジル] ヘプタンアミドの製造:

2-メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカプトベンゾチアゾールを用いて実施例47と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 129-130℃

IR (KBr) cm^{-1} : 3436, 3245, 2922, 1661,
1506, 1428.

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.44 - 1.54 (4H, m), 1.62 - 1.71 (2H, m),
1.83 (2H, quint, $J = 7.2$ Hz), 2.13 - 2.33 (2H, m), 2.39 (3H, s),
2.42 (3H, s), 2.45 (3H, s), 3.37 (2H, t, $J = 7.2$ Hz), 6.86 (1H, s),
7.34 (1H, td, $J = 7.8, 1.2$ Hz), 7.45 (1H, td, $J = 7.8, 1.2$ Hz),
7.84 (1H, dd, $J = 7.8, 1.2$ Hz), 7.94 (1H, dd, $J = 7.8, 1.2$ Hz),
8.81 (1H, br s).

EMS m/z (relative intensity): 477 (M^+), 200 (100).

元素分析: $\text{C}_{22}\text{H}_{27}\text{N}_3\text{O}_2\text{S}_4$ として

計算値: C, 55.31; H, 5.70; N, 8.80.

実測値: C, 55.41; H, 5.71; N, 8.64.

実施例52 (表中の化合物番号797の化合物)

8-(ベンゾチアゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル] オクタンアミドの製造:

2-メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカプトベンゾチアゾールを用いて実施例48と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 104-108℃

IR (KBr) cm^{-1} : 3242, 2925, 1665, 1508,
1459, 1428.

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.30 - 1.51 (6H, m), 1.55 - 1.69 (2H, m),
 1.81 (2H, quint, $J = 7.1$ Hz), 2.23 - 2.29 (2H, m),
 2.38 (3H, s), 2.41 (3H, s), 2.44 (3H, s), 3.35 (2H, t, $J = 7.2$ Hz)
 6.83 (1H, s), 7.32 (1H, m), 7.43 (1H, m), 7.81 (1H, m),
 7.91 (1H, m), 8.76 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 491 (M^+), 200 (100).

実施例 5 3 (表中の化合物番号 8 0 1 の化合物)

2 - (ベンズイミダゾール-2-イルチオ) - N - [2, 4-ビス(メチルチオ) - 6-メチル-3-ピリジル] アセトアミドの製造:

2-メルカプトベンゾチアゾールの代わりに2-メルカプトベンズイミダゾールを用いて実施例 4 9 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色結晶として得た。

融点 : 235 - 237 °C (d.)

IR (KBr) cm^{-1} : 3429, 3243, 2978, 2923,
 1661, 1505, 1439.

1H -NMR (CDCl₃) δ :

2.35 (3H, s), 2.46 (3H, s), 2.47 (3H, s), 4.03 (2H, s),
 6.63 (1H, s), 7.21 (1H, t, $J = 6.1$ Hz), 7.22 (1H, t, $J = 6.1$ Hz),
 7.43 - 7.60 (2H, m), 9.43 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 390 (M^+), 344 (100).

実施例 5 4 (表中の化合物番号 8 0 4 の化合物)

5 - (ベンズイミダゾール-2-イルチオ) - N - [2, 4-ビス(メチルチオ) - 6-メチル-3-ピリジル] ペンタンアミドの製造:

2-メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカプトベンズイミダゾールを用いて実施例 4 6 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色結晶として得た。

融点 : 176 - 177 °C

1H -NMR (d₆-DMSO) δ :

1.74 - 1.84 (4H, m), 2.26 - 2.35 (2H, m), 2.36 (3H, s),
2.39 (3H, s), 2.43 (3H, s), 3.26 - 3.36 (2H, m), 6.84 (1H, s),
7.04 - 7.13 (2H, m), 7.34 - 7.45 (2H, m), 8.84 (1H, br s),
12.06 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 432 (M^+), 200 (100).

実施例 5 5 (表中の化合物番号 8 0 6 の化合物)

7 - (ベンズイミダゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ビス (メチルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] ヘプタンアミドの製造:

2 - メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに 2 - メルカプトベンズイミダゾールを用いて実施例 4 7 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色プリズム晶として得た。

融点 : 189 - 192 °C

I R (KBr) cm^{-1} : 3139, 2925, 2854, 1668,
1561, 1523, 1435, 1401.

1H -NMR (d_6 -DMSO) δ :

1.39 - 1.52 (4H, m), 1.56 - 1.70 (2H, m),
1.75 (2H, quint, $J = 7.1$ Hz), 2.28 - 2.34 (2H, m), 2.38 (3H, s),
2.40 (3H, s), 2.43 (3H, s), 3.27 (2H, t, $J = 7.1$ Hz),
6.84 (1H, s), 7.07 (1H, t, $J = 7.1$ Hz), 7.08 (1H, t, $J = 7.1$ Hz),
7.32 (1H, d, $J = 7.1$ Hz), 7.46 (1H, d, $J = 7.1$ Hz),
8.79 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 460 (M^+), 150 (100).

実施例 5 6 (表中の化合物番号 8 0 7 の化合物)

8 - (ベンゾイミダゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ビス (メチルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] オクタンアミドの製造:

2 - メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに 2 - メルカプトベンゾイミダゾールを用いて実施例 4 8 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色結晶として得

た。

融点 : 186 - 187 °C

IR (KBr) cm^{-1} : 3430, 3222, 2925, 1661,
1564, 1522, 1437, 808.

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.35 - 1.43 (4H, m), 1.47 (2H, quint, $J = 7.2$ Hz),
1.60 - 1.68 (2H, m), 1.76 (2H, quint, $J = 7.2$ Hz),
2.23 - 2.32 (2H, m), 2.40 (3H, s), 2.42 (3H, s), 2.45 (3H, s),
3.28 (2H, t, $J = 7.2$ Hz), 6.89 (1H, s), 7.09 (1H, t, $J = 5.9$ Hz),
7.09 (1H, t, $J = 5.9$ Hz), 7.40 (1H, d, $J = 5.9$ Hz),
7.41 (1H, d, $J = 5.9$ Hz), 8.80 (1H, br s), 12.09 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 474 (M^+), 150 (100).

実施例 57 (表中の化合物番号 813 の化合物)

4 - (ベンゾオキサゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ビス (エチルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] ブタンアミドの製造:

6 - ブロモヘキサン酸クロリドの代わりに 4 - ブロモブタン酸クロリドを用いて実施例 27 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色結晶として得た。

融点 : 123 - 125 °C

IR (KBr) cm^{-1} : 3436, 3239, 2974, 2929,
1656, 1502, 1454, 1130.

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.23 - 1.28 (6H, m), 2.12 - 2.19 (2H, m), 2.43 (3H, s),
2.48 - 2.50 (2H, m), 2.93 (2H, q, $J = 7.1$ Hz),
3.06 (2H, q, $J = 7.1$ Hz), 3.41 - 3.48 (2H, m), 6.89 (3H, s),
7.29 - 7.34 (2H, m), 7.56 - 7.62 (2H, m), 8.96 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 447 (M^+), 227 (100).

実施例 58 (表中の化合物番号 814 の化合物)

5 - (ベンゾオキサゾール-2-イルチオ) - N - [2, 4-ビス(エチルチオ) - 6-メチル-3-ピリジル] ペンタンアミドの製造:

6-ブロモヘキサン酸クロリドの代わりに5-ブロモペンタン酸クロリドを用いて実施例27と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 122 - 123 °C.

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.25 (3H, t, $J = 7.3$ Hz), 1.26 (3H, t, $J = 7.3$ Hz),
1.76 - 1.87 (2H, m), 1.87 - 1.97 (2H, m),
2.29 - 2.40 (2H, m), 2.43 (3H, s), 2.92 (2H, q, $J = 7.3$ Hz),
3.05 (2H, q, $J = 7.3$ Hz), 3.38 (2H, t, $J = 7.2$ Hz), 6.88 (1H, s),
7.26 - 7.35 (2H, m), 7.55 - 7.60 (2H, m), 8.82 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 461 (M^+), 227 (100).

実施例59(表中の化合物番号816の化合物)

7 - (ベンゾオキサゾール-2-イルチオ) - N - [2, 4-ビス(エチルチオ) - 6-メチル-3-ピリジル] ヘブタンアミドの製造:

6-ブロモヘキサン酸クロリドの代わりに7-ブロモヘブタン酸クロリドを用いて実施例27と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 103 - 105 °C.

IR (KBr) cm^{-1} : 3247, 1663, 1501, 1455.

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.24 (3H, t, $J = 7.3$ Hz), 1.25 (3H, t, $J = 7.3$ Hz),
1.38 - 1.54 (4H, m), 1.57 - 1.72 (2H, m), 1.73 - 1.89 (2H, m),
2.19 - 2.32 (2H, m), 2.41 (3H, s), 2.92 (2H, q, $J = 7.3$ Hz),
3.05 (2H, q, $J = 7.3$ Hz), 3.33 (2H, t, $J = 7.1$ Hz), 6.86 (1H, s),
7.24 - 7.32 (2H, m), 7.52 - 7.60 (2H, m), 8.65 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 489 (M^+), 228 (100).

実施例60(表中の化合物番号817の化合物)

8 - (ベンゾオキサゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ビス (エチルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] オクタンアミドの製造:

6 - ブロモヘキサン酸クロリドの代わりに 8 - ブロモオクタン酸クロリドを用いて実施例 27 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 82 - 84 °C

IR (KBr) cm^{-1} : 3449, 3245, 2932, 1669,
1500, 1455, 1132.

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.26 (3H, t, $J = 7.3$ Hz), 1.27 (3H, t, $J = 7.3$ Hz),
1.37 - 1.42 (4H, m), 1.48 (2H, quint, $J = 7.2$ Hz),
1.60 - 1.67 (2H, m), 1.82 (2H, quint, $J = 7.2$ Hz),
2.24 - 2.30 (2H, m), 2.43 (3H, s), 2.94 (2H, q, $J = 7.3$ Hz),
3.07 (2H, q, $J = 7.3$ Hz), 3.34 (2H, t, $J = 7.2$ Hz), 6.88 (1H, s),
7.27 - 7.33 (2H, m), 7.56 - 7.61 (2H, m), 8.73 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 503 (M^+), 229 (100).

実施例 61 (表中化合物番号 823 の化合物)

4 - (ベンゾチアゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ビス (エチルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] ブタンアミドの製造:

2 - メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに 2 - メルカプトベンゾチアゾールを用いて実施例 57 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

融点 : 119 - 120 °C

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.25 (3H, t, $J = 7.4$ Hz), 1.26 (3H, t, $J = 7.4$ Hz),
2.07 - 2.23 (2H, m), 2.43 (3H, s), 2.45 - 2.55 (2H, m),
2.93 (2H, q, $J = 7.4$ Hz), 3.06 (2H, q, $J = 7.4$ Hz),
3.41 - 3.54 (2H, m), 6.89 (1H, s), 7.35 (1H, t, $J = 8.1$ Hz),
7.45 (1H, t, $J = 8.1$ Hz), 7.83 (1H, d, $J = 8.1$ Hz).

7.94 (1H, d, $J = 8.1$ Hz), 8.95 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 463 (M^+), 229 (100).

実施例 6 2 (表中の化合物番号 8 2 4 の化合物)

5 - (ベンゾチアゾール-2-イルチオ) - N - [2, 4-ビス(エチルチオ) - 6-メチル-3-ピリジル] ペンタンアミドの製造:

2-メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカプトベンゾチアゾールを用いて実施例 5 8 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 102 - 104 °C

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.25 (3H, t, $J = 7.3$ Hz), 1.26 (3H, t, $J = 7.3$ Hz),

1.77 - 1.88 (2H, m), 1.88 - 2.00 (2H, m), 2.29 - 2.41 (2H, m),

2.43 (3H, s), 2.93 (2H, q, $J = 7.3$ Hz), 3.06 (2H, q, $J = 7.3$ Hz),

3.41 (2H, t, $J = 7.0$ Hz), 6.89 (1H, s),

7.35 (1H, ddd, $J = 8.2, 7.2, 1.2$ Hz),

7.45 (1H, ddd, $J = 8.2, 7.2, 1.2$ Hz),

7.84 (1H, dd, $J = 8.2, 1.2$ Hz), 7.94 (1H, dd, $J = 8.2, 1.2$ Hz),

8.84 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 477 (M^+), 229 (100).

実施例 6 3 (表中の化合物番号 8 2 6 の化合物)

7 - (ベンゾチアゾール-2-イルチオ) - N - [2, 4-ビス(エチルチオ) - 6-メチル-3-ピリジル] ヘプタンアミドの製造:

2-メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカプトベンゾチアゾールを用いて実施例 5 9 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 114 - 116 °C

IR (KBr) cm^{-1} : 3245, 1665, 1536, 1509,

1 4 2 6 .

 $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.24 (3H, t, $J = 7.3$ Hz), 1.25 (3H, t, $J = 7.3$ Hz),
 1.39 - 1.56 (4H, m), 1.58 - 1.71 (2H, m), 1.75 - 1.88 (2H, m),
 2.19 - 2.31 (2H, m), 2.42 (3H, s), 2.92 (2H, q, $J = 7.3$ Hz),
 3.05 (2H, q, $J = 7.3$ Hz), 3.35 (2H, t, $J = 7.2$ Hz), 6.86 (1H, s),
 7.32 (1H, td, $J = 7.6$, 1.2 Hz), 7.42 (1H, td, $J = 7.6$, 1.2 Hz),
 7.81 (1H, dd, $J = 7.6$, 1.2 Hz), 7.91 (1H, dd, $J = 7.6$, 1.2 Hz),
 8.67 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 505 (M^+), 227 (100).

実施例 6 4 (表中の化合物番号 8 2 7 の化合物)

8 - (ベンゾチアゾール-2-イルチオ) - N - [2, 4-ビス (エチルチオ) - 6-メチル-3-ピリジル] オクタンアミドの製造:

2-メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカプトベンゾチアゾールを用いて実施例 6 0 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 94 - 96 °C

IR (KBr) cm^{-1} : 3433, 3243, 2929, 1669,
 1511, 1428.

 $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.26 (3H, t, $J = 7.3$ Hz), 1.27 (3H, t, $J = 7.3$ Hz),
 1.37 - 1.43 (4H, m), 1.45 - 1.52 (2H, m), 1.57 - 1.68 (2H, m),
 1.82 (2H, quint, $J = 7.2$ Hz), 2.20 - 2.32 (2H, m), 2.43 (3H, s),
 2.94 (2H, q, $J = 7.3$ Hz), 3.07 (2H, q, $J = 7.3$ Hz),
 3.37 (2H, t, $J = 7.2$ Hz), 6.88 (1H, s),
 7.34 (1H, td, $J = 7.6$, 1.1 Hz), 7.44 (1H, td, $J = 7.6$, 1.1 Hz),
 7.83 (1H, dd, $J = 7.6$, 1.1 Hz), 7.93 (1H, dd, $J = 7.6$, 1.1 Hz),
 8.73 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 519 (M^+), 227 (100).

実施例 6 5 (表中の化合物番号 8 3 3 の化合物)

4 - (ベンズイミダゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ビス (エチルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] ブタンアミドの製造:

2 - メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに 2 - メルカプトベンズイミダゾールを用いて実施例 5 7 と同様に反応・処理し、目的化合物を淡黄色粉末晶として得た。

融点 : 160 - 161 °C

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.25 (3H, t, $J = 7.3$ Hz), 1.26 (3H, t, $J = 7.3$ Hz),

2.27 - 2.37 (2H, m), 2.44 (3H, s),

2.48 - 2.50 (2H, m), 2.93 (2H, q, $J = 7.3$ Hz),

3.06 (2H, q, $J = 7.3$ Hz), 3.34 - 3.46 (2H, m), 6.89 (1H, s),

7.05 - 7.14 (2H, m), 7.33 (1H, m), 7.46 (1H, m), 8.95 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 446 (M^+), 195 (100).

実施例 6 6 (表中の化合物番号 8 3 4 の化合物)

5 - (ベンズイミダゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ビス (エチルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] ペンタンアミドの製造:

2 - メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに 2 - メルカプトベンズイミダゾールを用いて実施例 5 8 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 163 - 165 °C

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.23 (3H, t, $J = 7.3$ Hz), 1.24 (3H, t, $J = 7.3$ Hz),

1.74 - 1.88 (4H, m), 2.27 - 2.38 (2H, m),

2.41 (3H, s), 2.90 (2H, q, $J = 7.3$ Hz), 3.03 (2H, q, $J = 7.3$ Hz),

3.26 - 3.34 (2H, m), 6.86 (1H, s), 7.04 - 7.11 (2H, m),

7.32 (1H, m), 7.46 (1H, m), 8.79 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 460 (M^+), 195 (100).

実施例 67 (表中の化合物番号 836 の化合物)

7-(ベンズイミダゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ヘプタンアミドの製造:

2-メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカプトベンズイミダゾールを用いて実施例 59 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 151-156℃

IR (KBr) cm^{-1} : 3136, 3106, 1656, 1518,
1438, 1401, 1337, 1268.

1H -NMR (d₆-DMSO) δ :

1.24 (3H, t, $J = 7.3$ Hz), 1.25 (3H, t, $J = 7.3$ Hz),
1.36 - 1.54 (4H, m), 1.55 - 1.82 (4H, m), 2.15 - 2.32 (2H, m),
2.41 (3H, s), 2.92 (2H, q, $J = 7.3$ Hz), 3.05 (2H, q, $J = 7.3$ Hz),
3.26 (2H, t, $J = 7.3$ Hz), 6.86 (1H, s),
7.03 - 7.11 (2H, m), 7.34 - 7.44 (2H, m), 8.67 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 488 (M^+), 151 (100).

実施例 68 (表中の化合物番号 837 の化合物)

8-(ベンゾイミダゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]オクタンアミドの製造:

2-メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカプトベンゾイミダゾールを用いて実施例 60 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色結晶として得た。

融点 : 166-168℃

IR (KBr) cm^{-1} : 3427, 3147, 2928, 1660,
1560, 1526, 1437.

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{d}_6\text{-DMSO}$) δ :

1.26 (3H, t, $J = 7.3$ Hz), 1.27 (3H, t, $J = 7.3$ Hz),
 1.36 - 1.41 (4H, m), 1.47 (2H, quint, $J = 7.2$ Hz),
 1.60 - 1.67 (2H, m), 1.75 (2H, quint, $J = 7.2$ Hz),
 2.22 - 2.32 (2H, m), 2.43 (3H, s), 2.94 (2H, q, $J = 7.3$ Hz),
 3.07 (2H, q, $J = 7.3$ Hz), 3.28 (2H, t, $J = 7.2$ Hz), 6.88 (1H, s),
 7.08 (1H, t, $J = 5.9$ Hz), 7.09 (1H, t, $J = 5.9$ Hz),
 7.40 (1H, d, $J = 5.9$ Hz), 7.41 (1H, d, $J = 5.9$ Hz),
 8.73 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 502 (M^+), 151 (100).

実施例 69 (表中の化合物番号 843 の化合物)

4 - (ベンゾオキサゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ビス (イソプロピルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] ブタンアミドの製造:

6 - プロモヘキサン酸クロリドの代わりに 4 - プロモブタン酸クロリドを用いて実施例 36 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 128 - 129 °C

IR (KBr) cm^{-1} : 3448, 3235, 2962, 1683,
 1657, 1555, 1515, 1500,
 1456, 1131.

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{d}_6\text{-DMSO}$) δ :

1.27 (6H, d, $J = 6.6$ Hz), 1.30 (6H, d, $J = 6.8$ Hz),
 2.10 - 2.17 (2H, m), 2.42 (3H, s),
 2.47 - 2.50 (2H, m), 3.39 - 3.47 (2H, m),
 3.55 (1H, sept, $J = 6.6$ Hz), 3.89 (1H, sept, $J = 6.8$ Hz),
 6.92 (1H, s), 7.28 (1H, td, $J = 7.3, 1.7$ Hz),
 7.30 (1H, td, $J = 7.3, 1.7$ Hz), 7.56 (1H, dd, $J = 7.3, 1.7$ Hz),
 7.58 (1H, dd, $J = 7.3, 1.7$ Hz), 8.90 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 475 (M^+), 207 (100).

実施例 70 (表中の化合物番号 844 の化合物)

5 - (ベンゾオキサゾール-2-イルチオ) - N - [2, 4-ビス(イソプロピルチオ) - 6-メチル-3-ピリジル] ペンタンアミドの製造:

6-ブロモヘキサン酸クロリドの代わりに5-ブロモペンタン酸クロリドを用いて実施例 36 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色プリズム晶として得た。

融点 : 129 - 130 °C

I R (K B r) cm^{-1} : 3448, 3215, 3167, 2965,
1654, 1555, 1525, 1500,
1454, 1128.

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.27 (6H, d, $J = 6.8 \text{ Hz}$), 1.30 (6H, d, $J = 6.8 \text{ Hz}$),
1.75 - 1.85 (2H, m), 1.86 - 1.96 (2H, m), 2.26 - 2.40 (2H, m),
2.42 (3H, s), 3.37 (2H, t, $J = 7.1 \text{ Hz}$),
3.54 (1H, sept, $J = 6.8 \text{ Hz}$), 3.88 (1H, sept, $J = 6.8 \text{ Hz}$),
6.91 (1H, s), 7.27 (1H, td, $J = 7.6, 1.7 \text{ Hz}$),
7.30 (1H, td, $J = 7.6, 1.7 \text{ Hz}$), 7.55 (1H, dd, $J = 7.6, 1.7 \text{ Hz}$),
7.58 (1H, dd, $J = 7.6, 1.7 \text{ Hz}$), 8.75 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 489 (M^+), 221 (100).

実施例 71 (表中の化合物番号 846 の化合物)

7 - (ベンゾオキサゾール-2-イルチオ) - N - [2, 4-ビス(イソプロピルチオ) - 6-メチル-3-ピリジル] ヘプタンアミドの製造:

6-ブロモヘキサン酸クロリドの代わりに7-ブロモヘプタン酸クロリドを用いて実施例 36 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 76 - 78 °C

I R (K B r) cm^{-1} : 3436, 3265, 2929, 1663,
1503, 1455.

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.29 (6H, d, $J = 6.8$ Hz), 1.32 (6H, d, $J = 6.8$ Hz),
 1.43 - 1.54 (4H, m), 1.65 (2H, quint, $J = 7.2$ Hz),
 1.83 (2H, quint, $J = 7.2$ Hz), 2.20 - 2.33 (2H, m), 2.43 (3H, s),
 3.35 (2H, t, $J = 7.2$ Hz), 3.56 (1H, sept, $J = 6.8$ Hz),
 3.90 (1H, sept, $J = 6.8$ Hz), 6.93 (1H, s), 7.27 - 7.34 (2H, m),
 7.56 - 7.61 (2H, m), 8.72 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 517 (M^+), 249 (100).

実施例 7 2 (表中の化合物番号 8 4 7 の化合物)

8 - (ベンゾオキサゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ビス (イソプロピルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] オクタンアミドの製造:

6 - ブロモヘキサン酸クロリドの代わりに 8 - ブロモオクタン酸クロリドを用いて実施例 3 6 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色油状物として得た。

I R (K B r) cm^{-1} : 3241, 1664, 1559, 1526,
 1501, 1454.

1H -NMR (d_6 -DMSO) δ :

1.29 (6H, d, $J = 6.8$ Hz), 1.31 (6H, d, $J = 6.8$ Hz),
 1.34 - 1.54 (6H, m), 1.55 - 1.69 (2H, m), 1.73 - 1.89 (2H, m),
 2.15 - 2.28 (2H, m), 2.42 (3H, s), 3.27 (2H, t, $J = 7.3$ Hz),
 3.54 (1H, sept, $J = 6.8$ Hz), 3.89 (1H, sept, $J = 6.8$ Hz),
 6.90 (1H, s), 7.24 - 7.32 (2H, m), 7.51 - 7.60 (2H, m),
 8.59 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 531 (M^+), 263 (100).

実施例 7 3 (表中の化合物番号 8 4 8 の化合物)

9 - (ベンゾオキサゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ビス (イソプロピルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] ノナンアミドの製造:

6 - ブロモヘキサン酸クロリドの代わりに 9 - ブロモノナン酸クロリドを用いて実施例 3 6 と同様に反応・処理し、目的化合物を淡黄色油状物質として得た。

I R (C a p) c m⁻¹: 3 2 4 3, 2 9 6 2, 2 9 2 7, 1 6 6 8,
1 5 5 8, 1 5 0 5, 1 4 5 5, 1 1 3 0.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ:

1.28 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.31 (6H, d, J = 6.8 Hz),
1.28 - 1.50 (8H, m), 1.55 - 1.65 (2H, m),
1.80 (2H, quint, J = 7.3 Hz), 2.17 - 2.27 (2H, m),
2.42 (3H, s), 3.32 (2H, t, J = 7.3 Hz),
3.55 (1H, sept, J = 6.8 Hz), 3.89 (1H, sept, J = 6.8 Hz),
6.91 (1H, s), 7.27 (1H, td, J = 7.3, 1.7 Hz),
7.30 (1H, td, J = 7.3, 1.7 Hz), 7.54 - 7.60 (2H, m),
8.65 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 545 (M⁺), 277 (100).

実施例 7 4 (表中の化合物番号 8 5 1 の化合物)

2 - (ベンゾチアゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ビス (イソプロピルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] アセトアミドの製造:

2 - ブロモ - N - [2, 4 - ビス (メチルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] アセトアミドの代わりに 2 - ブロモ - N - [2, 4 - ビス (イソプロピルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] アセトアミドを用いて実施例 4 9 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 1 1 7 - 1 1 8 °C

I R (K B r) c m⁻¹: 3 4 3 1, 3 1 7 9, 2 9 6 7, 1 6 6 0,
1 5 5 9, 1 5 2 6, 1 4 2 8.

¹H-NMR (C D C l₃) δ:

1.19 (6H, d, J = 6.7 Hz), 1.21 (6H, d, J = 6.7 Hz), 2.41 (3H, s),
3.39 (1H, sept, J = 6.7 Hz), 3.92 (1H, sept, J = 6.7 Hz),
4.18 (2H, s), 6.68 (1H, s), 7.32 (1H, td, J = 7.7, 1.2 Hz),
7.41 (1H, td, J = 7.7, 1.2 Hz), 7.77 (1H, d, J = 7.7 Hz),
7.91 (1H, d, J = 7.7 Hz), 8.80 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 463 (M^+), 180 (100).

元素分析 : $C_{21}H_{25}N_3OS_4$ として

計算値 : C, 54.39; H, 5.43; N, 9.06; S, 27.66.

実測値 : C, 54.28; H, 5.45; N, 8.93; S, 27.73.

実施例 75 (表中の化合物番号 853 の化合物)

4 - (ベンゾチアゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ビス (イソプロピルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] ブタンアミドの製造 :

2 - メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに 2 - メルカプトベンゾチアゾールを用いて実施例 69 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

融点 : 116 - 117 °C

IR (KBr) cm^{-1} : 3450, 3257, 2962, 1667,
1557, 1510, 1457, 1429,
987.

1H -NMR (d_6 -DMSO) δ :

1.27 (6H, d, $J = 6.8$ Hz), 1.30 (6H, d, $J = 6.8$ Hz),
2.08 - 2.17 (2H, m), 2.42 (3H, s),
2.43 - 2.47 (2H, m), 3.45 (2H, t, $J = 7.1$ Hz),
3.55 (1H, sept, $J = 6.8$ Hz),
3.89 (1H, sept, $J = 6.8$ Hz), 6.92 (1H, s), 7.33 (1H, t, $J = 7.8$ Hz),
7.43 (1H, t, $J = 7.8$ Hz), 7.81 (1H, d, $J = 7.8$ Hz),
7.92 (1H, d, $J = 7.8$ Hz), 8.90 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 491 (M^+), 69 (100).

実施例 76 (表中の化合物番号 854 の化合物)

5 - (ベンゾチアゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ビス (イソプロピルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] ペンタンアミドの製造 :

2 - メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに 2 - メルカプトベンゾチアゾー

ルを用いて実施例 70 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

融点 : 107 - 109 °C

IR (KBr) cm^{-1} : 3441, 3215, 2963, 1656,
1557, 1523, 1460, 1429,
996.

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.27 (6H, d, $J = 6.8$ Hz), 1.30 (6H, d, $J = 6.8$ Hz),
1.76 - 1.85 (2H, m), 1.86 - 1.96 (2H, m), 2.26 - 2.40 (2H, m),
2.42 (3H, s), 3.39 (2H, t, $J = 7.1$ Hz),
3.54 (1H, sept, $J = 6.8$ Hz), 3.89 (1H, sept, $J = 6.8$ Hz),
6.91 (1H, s), 7.33 (1H, td, $J = 8.1, 1.2$ Hz),
7.43 (1H, td, $J = 8.1, 1.2$ Hz), 7.82 (1H, dd, $J = 8.1, 1.2$ Hz),
7.92 (1H, dd, $J = 8.1, 1.2$ Hz), 8.75 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 505 (M^+), 221 (100).

実施例 77 (表中の化合物番号 855 の化合物)

6 - (ベンゾチアゾール-2-イルチオ) - N - [2, 4-ビス(イソプロピルチオ) - 6-メチル-3-ピリジル] ヘキサンアミドの製造:

2-メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに 2-メルカプトベンゾチアゾールを用いて実施例 36 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色結晶として得た。

融点 : 84 - 86 °C

IR (KBr) cm^{-1} : 3436, 3212, 2961, 2925,
1655, 1555, 1522, 1428.

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.30 (6H, d, $J = 6.6$ Hz), 1.33 (6H, d, $J = 6.8$ Hz),
1.54 - 1.62 (2H, m), 1.65 - 1.73 (2H, m),
1.85 (2H, quint, $J = 7.0$ Hz), 2.22 - 2.33 (2H, m), 2.43 (3H, s),
3.38 (2H, t, $J = 7.0$ Hz), 3.57 (1H, sept, $J = 6.6$ Hz).

3.91 (1H, sept, $J = 6.8$ Hz), 6.93 (1H, s), 7.34 (1H, t, $J = 7.8$ Hz),
 7.44 (1H, t, $J = 7.8$ Hz), 7.83 (1H, d, $J = 7.8$ Hz),
 7.93 (1H, d, $J = 7.8$ Hz), 8.73 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 519 (M^+), 235 (100).

実施例 78 (表中の化合物番号 856 の化合物)

7 - (ベンゾチアゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ビス (イソプロピルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] ヘプタンアミドの製造:

2 - メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに 2 - メルカプトベンゾチアゾールを用いて実施例 71 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色結晶として得た。

融点 : 74 - 76 °C

IR (KBr) cm^{-1} : 3436, 3200, 3158, 2961,
 2928, 1654, 1525, 1427.

1H -NMR (d_6 -DMSO) δ :

1.29 (6H, d, $J = 6.6$ Hz), 1.32 (6H, d, $J = 6.8$ Hz),
 1.43 - 1.55 (4H, m), 1.65 (2H, quint, $J = 7.2$ Hz),
 1.83 (2H, quint, $J = 7.2$ Hz), 2.22 - 2.33 (2H, m), 2.43 (3H, s),
 3.37 (2H, t, $J = 7.2$ Hz), 3.56 (1H, sept, $J = 6.6$ Hz),
 3.90 (1H, sept, $J = 6.8$ Hz), 6.93 (1H, s),
 7.34 (1H, td, $J = 7.7, 1.2$ Hz), 7.44 (1H, td, $J = 7.7, 1.2$ Hz),
 7.83 (1H, dd, $J = 7.7, 1.2$ Hz), 7.94 (1H, dd, $J = 7.7, 1.2$ Hz),
 8.68 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 533 (M^+), 249 (100).

実施例 79 (表中の化合物番号 857 の化合物)

8 - (ベンゾチアゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ビス (イソプロピルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] オクタンアミドの製造:

2 - メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに 2 - メルカプトベンゾチアゾールを用いて実施例 72 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得

た。

融点 : 107 - 108℃

I R (K B r) cm^{-1} : 3239, 1664, 1559, 1526,
1456, 1428.

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.29 (6H, d, $J = 6.8 \text{ Hz}$), 1.31 (6H, d, $J = 6.8 \text{ Hz}$),
1.34 - 1.54 (6H, m), 1.55 - 1.70 (2H, m), 1.73 - 1.88 (2H, m),
2.15 - 2.29 (2H, m), 2.42 (3H, s), 3.35 (2H, t, $J = 7.3 \text{ Hz}$),
3.54 (1H, sept, $J = 6.8 \text{ Hz}$), 3.89 (1H, sept, $J = 6.8 \text{ Hz}$),
6.90 (1H, s), 7.31 (1H, t, $J = 7.8 \text{ Hz}$), 7.42 (1H, t, $J = 7.8 \text{ Hz}$),
7.81 (1H, d, $J = 7.8 \text{ Hz}$), 7.90 (1H, d, $J = 7.8 \text{ Hz}$),
8.59 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 547 (M^+), 263 (100).

実施例 80 (表中の化合物番号 858 の化合物)

9 - (ベンゾチアゾール-2-イルチオ) - N - [2, 4-ビス (イソプロピルチオ) - 6-メチル-3-ピリジル] ノナンアミドの製造:

2-メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカプトベンゾチアゾールを用いて実施例73と同様に反応・処理し、目的化合物を淡黄色油状物質として得た。

I R (C a p) cm^{-1} : 3243, 2962, 2927, 1668,
1559, 1526, 1456.

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.28 (6H, d, $J = 6.8 \text{ Hz}$), 1.31 (6H, d, $J = 6.8 \text{ Hz}$),
1.28 - 1.50 (8H, m), 1.55 - 1.65 (2H, m),
1.80 (2H, quint, $J = 7.0 \text{ Hz}$), 2.17 - 2.27 (2H, m),
2.42 (3H, s), 3.34 (2H, t, $J = 7.0 \text{ Hz}$),
3.55 (1H, sept, $J = 6.8 \text{ Hz}$), 3.89 (1H, sept, $J = 6.8 \text{ Hz}$),
6.91 (1H, s), 7.32 (1H, td, $J = 7.1, 1.2 \text{ Hz}$),

7.43 (1H, td, $J = 7.1, 1.2$ Hz), 7.81 (1H, dd, $J = 7.1, 1.2$ Hz),
7.91 (1H, dd, $J = 7.1, 1.2$ Hz), 8.65 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 561 (M^+), 277 (100).

実施例 8 1 (表中の化合物番号 8 6 1 の化合物)

2-(ベンズイミダゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(イソプロピルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]アセトアミドの製造:

2-ブロモ-N-[2,4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-メチルピリジル]アセトアミドの代わりに2,4-ビス(イソプロピルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]アセトアミドを用いて実施例 5 3 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 223-224°C

IR (KBr) cm^{-1} : 3437, 3138, 3106, 2960,
1668, 1534, 1414.

1H -NMR (CDCl₃) δ :

1.22 (6H, d, $J = 6.8$ Hz), 1.25 (6H, d, $J = 6.8$ Hz), 2.42 (3H, s),
3.41 (1H, sept, $J = 6.8$ Hz), 3.95 (1H, sept, $J = 6.8$ Hz),
4.05 (2H, s), 6.69 (1H, s), 7.18 (1H, t, $J = 6.1$ Hz),
7.19 (1H, t, $J = 6.1$ Hz), 7.34 (1H, br s), 7.62 (1H, br s),
9.33 (1H, br s), 10.61 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 446 (M^+), 371 (100).

元素分析 : C₂₁H₂₆N₄O S₃として

計算値 : C, 56.47; H, 5.87; N, 12.54.

実測値 : C, 56.42; H, 5.87; N, 12.56.

実施例 8 2 (表中の化合物番号 8 6 3 の化合物)

4-(ベンズイミダゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(イソプロピルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ブタンアミドの製造:

2-メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカプトベンズイミダゾ

ールを用いて実施例 69 と同様に反応・処理し、目的化合物を淡黄色粉末晶として得た。

融点 : 209 - 211 °C

I R (K B r) cm^{-1} : 3480, 3196, 2963, 1664,
1557, 1529, 1428.

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.25 (6H, d, $J = 6.8 \text{ Hz}$), 1.28 (6H, d, $J = 6.8 \text{ Hz}$),
2.04 (2H, quint, $J = 7.1 \text{ Hz}$), 2.43 (3H, s),
2.44 (2H, t, $J = 7.1 \text{ Hz}$), 3.36 (2H, t, $J = 7.1 \text{ Hz}$),
3.61 (1H, sept, $J = 6.8 \text{ Hz}$), 3.86 (1H, sept, $J = 6.8 \text{ Hz}$),
6.96 (1H, s), 7.09 (1H, dd, $J = 7.3, 5.4 \text{ Hz}$),
7.12 (1H, dd, $J = 7.3, 5.4 \text{ Hz}$), 7.35 (1H, m), 7.49 (1H, m),
9.38 (1H, s), 12.53 (1H, s).

E I M S m/z (relative intensity): 474 (M^+), 207 (100).

実施例 83 (表中の化合物番号 864 の化合物)

5 - (ベンズイミダゾール-2-イルチオ) - N - [2, 4-ビス (イソプロピルチオ) - 6-メチル-3-ピリジル] ペンタンアミドの製造:

2-メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに 2-メルカプトベンズイミダゾールを用いて実施例 70 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

融点 : 175 - 176 °C

I R (K B r) cm^{-1} : 3447, 3195, 2965, 1663,
1557, 1526, 1428, 1400.

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.28 (6H, d, $J = 6.8 \text{ Hz}$), 1.30 (6H, d, $J = 6.8 \text{ Hz}$),
1.75 - 1.90 (4H, m), 2.26 - 2.38 (2H, m), 2.42 (3H, s),
3.30 (2H, t, $J = 7.1 \text{ Hz}$), 3.54 (1H, sept, $J = 6.8 \text{ Hz}$),
3.88 (1H, sept, $J = 6.8 \text{ Hz}$), 6.91 (1H, s),

7.07 (1H, t, J = 6.1 Hz), 7.08 (1H, t, J = 6.1 Hz),

7.32 (1H, d, J = 6.1 Hz), 7.46 (1H, d, J = 6.1 Hz),

8.72 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 488 (M⁺), 221 (100).

実施例 84 (表中化合物番号 865 の化合物)

6-(ベンズイミダゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(イソプロピルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ヘキサナムドの製造:

2-メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカプトベンズイミダゾールを用いて実施例 36 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

融点 : 175-176℃

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ:

1.30 (6H, d, J = 6.7 Hz), 1.32 (6H, d, J = 6.7 Hz),

1.47 - 1.61 (2H, m), 1.62 - 1.72 (2H, m),

1.73 - 1.84 (2H, m), 2.18 - 2.35 (2H, m),

2.43 (3H, s), 3.21 - 3.33 (2H, m), 3.55 (1H, sept, J = 6.7 Hz),

3.90 (1H, sept, J = 6.7 Hz), 6.92 (1H, s),

7.03 - 7.12 (2H, m), 7.33 (1H, m), 7.47 (1H, m),

8.75 (1H, br s), 12.05 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 502 (M⁺), 235 (100).

実施例 85 (表中の化合物番号 866 の化合物)

7-(ベンゾイミダゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(イソプロピルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ヘプタンアミドの製造:

2-メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカプトベンゾイミダゾールを用いて実施例 71 と同様に反応・処理し、目的化合物を淡黄色針状晶として得た。

融点 : 118-121℃

I R (K B r) cm^{-1} : 3 3 9 3, 3 2 1 9, 2 9 6 3, 2 9 2 8,
1 6 6 3, 1 5 5 9, 1 5 2 6, 1 4 3 9.

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.29 (6H, d, $J = 6.6$ Hz), 1.32 (6H, d, $J = 6.8$ Hz),
1.41 - 1.53 (4H, m), 1.64 (2H, quint, $J = 7.2$ Hz),
1.76 (2H, quint, $J = 7.2$ Hz), 2.18 - 2.33 (2H, m), 2.43 (3H, s),
3.28 (2H, t, $J = 7.2$ Hz), 3.56 (1H, sept, $J = 6.6$ Hz),
3.90 (1H, sept, $J = 6.8$ Hz), 6.93 (1H, s), 7.08 (1H, t, $J = 5.9$ Hz),
7.09 (1H, t, $J = 5.9$ Hz), 7.40 (1H, d, $J = 5.9$ Hz),
7.41 (1H, d, $J = 5.9$ Hz), 8.86 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 516 (M^+), 399 (100).

実施例 8 6 (表中の化合物番号 8 6 7 の化合物)

8 - (ベンズイミダゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ビス (イソプロピルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] オクタンアミドの製造:

2 - メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに 2 - メルカプトベンズイミダゾールを用いて実施例 7 2 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

融点 : 170 - 171 $^{\circ}\text{C}$

I R (K B r) cm^{-1} : 3 1 5 8, 2 9 6 3, 2 9 3 0, 1 6 6 5,
1 5 5 9, 1 5 2 6, 1 5 0 8, 1 4 2 9.

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.28 (6H, d, $J = 6.8$ Hz), 1.31 (6H, d, $J = 6.8$ Hz)
1.32 - 1.50 (6H, m), 1.56 - 1.66 (2H, m),
1.74 (2H, quint, $J = 7.3$ Hz), 2.17 - 2.27 (2H, m),
2.42 (3H, s), 3.26 (2H, t, $J = 7.3$ Hz),
3.54 (1H, sept, $J = 6.8$ Hz), 3.89 (1H, sept, $J = 6.8$ Hz),
6.91 (1H, s), 7.05 - 7.10 (2H, m), 7.32 (1H, m), 7.45 (1H, m),
8.65 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 530 (M^+), 413 (100).

実施例 87 (表中の化合物番号 868 の化合物)

9 - (ベンズイミダゾール-2-イルチオ) - N - [2, 4-ビス(イソプロピルチオ) - 6-メチル-3-ピリジル] ノナンアミドの製造:

2-メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカプトベンズイミダゾールを用いて実施例 73 と同様に反応・処理し、目的化合物を淡黄褐色粉末晶として得た。

融点 : 112 - 114 °C

I R (K B r) cm^{-1} : 3435, 3185, 2927, 1660,
1558, 1526, 1437.

1H -NMR (d₆-DMSO) δ :

1.28 (6H, d, $J = 6.8$ Hz), 1.31 (6H, d, $J = 6.8$ Hz),
1.28 - 1.48 (8H, m), 1.52 - 1.65 (2H, m),
1.73 (2H, quint, $J = 7.1$ Hz), 2.18 - 2.28 (2H, m),
2.42 (3H, s), 3.25 (2H, t, $J = 7.1$ Hz),
3.55 (1H, sept, $J = 6.8$ Hz), 3.89 (1H, sept, $J = 6.8$ Hz),
6.91 (1H, s), 7.07 (1H, t, $J = 6.1$ Hz), 7.08 (1H, t, $J = 6.1$ Hz),
7.32 (1H, d, $J = 6.1$ Hz), 7.46 (1H, d, $J = 6.1$ Hz),
8.80 (1H, br s), 12.05 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 544 (M^+), 151 (100).

実施例 88 (表中化合物番号 1145 の化合物)

6 - (ベンゾオキサゾール-2-イルチオ) - N - [2-メチル-4, 6-ビス(メチルチオ) - 5-ピリミジル] ヘキササンアミドの製造:

発煙硝酸 (3 ml) を氷冷し、攪拌しながら 4, 6-ジヒドロキシー-2-メチルピリミジン (1.0 g, 7.9 mmol) を徐々に加えた。氷冷下で 2 時間、室温で 1 時間攪拌後、反応液を氷中に加え、析出した結晶を濾取後乾燥し、4, 6-ジヒドロキシー-2-メチル-5-ニトロピリミジン 207 mg (収率 15 %) を得た。

このニトロピリミジン (205 mg, 1.2 mmol) を塩化ホスホリル (1 ml) に溶解し、ジエチルアニリン (281 mg, 1.9 mmol) を加え、100℃で1時間、120℃で1時間攪拌した。反応液を水中に加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を留去して得られた粗生成物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒; ヘキサン: 酢酸エチル = 20:1) で精製して、4, 6-ジクロロ-2-メチル-5-ニトロピリミジン 194 mg (収率 77%) を無色針状晶として得た。

ナトリウムチオメトキシド (780 mg, 10.6 mmol) のメタノール溶液 (10 ml) に、氷冷下で4, 6-ジクロロ-2-メチル-5-ニトロピリミジン (1.0 g, 4.81 mmol) のメタノール溶液 (10 ml) を滴下し、氷冷下で1時間攪拌後、反応混合物に水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を留去して得られた残渣を、酢酸エチル-ヘキサンより再結晶し、4, 6-ビス (メチルチオ) -2-メチル-5-ニトロピリミジン 609 mg (収率 55%) を得た。

このニトロピリミジン (100 mg, 0.43 mmol) のエタノール (100 ml) 溶液に炭酸カリウム (119 mg, 0.865 mmol)、二酸化白金 (40 mg, 0.18 mmol) を加え、水素雰囲気下で攪拌した。1.5時間後反応混合物を濾過し、濾液を留去して得られた粗生成物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒; ヘキサン: 酢酸エチル = 6:1) で精製して、5-アミノ-4, 6-ビス (メチルチオ) -2-メチルピリミジン 66 mg (収率 76%) を得た。

3-アミノ-2, 4-ビス (メチルチオ) -6-メチルピリジンの代わりに5-アミノ-4, 6-ビス (メチルチオ) -2-メチルピリミジンを用いて実施例18と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

融点 : 148 - 151℃

IR (KBr) cm^{-1} : 3440, 3245, 2929, 1660, 1530.

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

1.43 - 1.55 (2H, m), 1.57 - 1.69 (2H, m), 1.72 - 1.84 (2H, m),
2.14 - 2.29 (2H, m), 2.38 (6H, s), 2.48 (3H, m),

3.28 (2H, t, $J = 7.3$ Hz), 7.21 (1H, td, $J = 7.4$, 1.7 Hz),
 7.24 (1H, td, $J = 7.4$, 1.7 Hz), 7.49 (1H, dd, $J = 7.4$ Hz),
 7.51 (1H, dd, $J = 7.4$, 1.7 Hz), 8.91 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 448 (M^+ , 100).

実施例 89 (表中の化合物番号 1247 の化合物)

2-(7-トリフルオロメチルベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]アセトアミドの製造:

2-メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカプト-7-トリフルオロメチルベンゾオキサゾールを用いて実施例 49 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 207-209℃

IR (KBr) cm^{-1} : 3435, 3235, 1673, 1509,
 1433, 1329, 1130.

1H -NMR ($CDCl_3$) δ :

2.32 (3H, s), 2.41 (3H, s), 2.48 (3H, s), 4.14 (2H, s),
 6.81 (1H, s), 7.41 (1H, t, $J = 7.8$ Hz),
 7.52 (1H, d, $J = 7.8$ Hz), 7.79 (1H, d, $J = 7.8$ Hz),
 8.46 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 459 (M^+), 227 (100).

元素分析 : $C_{18}H_{16}F_3N_3O_2S_3$ として

計算値 : C, 47.05; H, 3.51; N, 9.14.

実測値 : C, 46.84; H, 3.66; N, 9.03.

実施例 90 (表中の化合物番号 1250 の化合物)

5-(7-トリフルオロメチルベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ペンタンアミドの製造:

2-メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカプト-7-トリフルオロメチルベンゾオキサゾールを用いて実施例46同様に反応・処理し、目的化合物を無色結晶として得た。

融点 : 179 - 180 °C.

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.75 - 1.87 (2H, m), 1.87 - 2.00 (2H, m),
2.37 (3H, s), 2.39 (3H, s), 2.30 - 2.39 (2H, m),
2.43 (3H, s), 3.36 - 3.46 (2H, m), 6.84 (1H, s),
7.50 (1H, t, $J = 7.9$ Hz), 7.59 (1H, d, $J = 7.9$ Hz),
7.89 (1H, d, $J = 7.9$ Hz), 8.85 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 501 (M^+), 200 (100).

実施例91 (表中の化合物番号1252の化合物)

7-(7-トリフルオロメチルベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ヘプタンアミドの製造:

2-メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカプト-7-トリフルオロメチルベンゾオキサゾールを用いて実施例47と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 129 - 131 °C

IR (KBr) cm^{-1} : 3247, 1662, 1505, 1435,
1337, 1128.

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.40 - 1.55 (4H, m), 1.60 - 1.71 (2H, m), 1.80 - 1.89 (2H, m),
2.20 - 2.34 (2H, m), 2.38 (3H, s), 2.40 (3H, s),
2.44 (3H, s), 3.37 (2H, t, $J = 7.1$ Hz), 6.84 (1H, s),
7.49 (1H, t, $J = 7.8$ Hz), 7.58 (1H, d, $J = 7.8$ Hz),
7.88 (1H, d, $J = 7.8$ Hz), 8.78 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 529 (M^+), 200 (100).

実施例 9 2 (表中化合物番号 1 2 5 3 の化合物)

8 - (7 - トリフルオロメチルベンゾオキサゾール - 2 - イルチオ) - N -
[2 , 4 - ビス (メチルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] オクタンアミドの
製造 :

2 - メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに 2 - メルカプト - 7 - トリフル
オロメチルベンゾオキサゾールを用いて実施例 4 8 と同様に反応・処理し、目的
化合物を無色粉末晶として得た。

融点 : 115 - 116 °C

¹H - NMR (d₆-DMSO) δ :

1.40 - 1.54 (6H, m), 1.56 - 1.72 (2H, m),
1.85 (2H, quint, J = 7.0 Hz), 2.18 - 2.36 (2H, m),
2.40 (3H, s), 2.43 (3H, s), 2.46 (3H, s), 3.38 (2H, t, J = 7.3 Hz),
6.86 (1H, s), 7.51 (1H, t, J = 7.5 Hz), 7.60 (1H, d, J = 7.5 Hz),
7.90 (1H, d, J = 7.5 Hz), 8.16 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 543 (M⁺), 200 (100).

実施例 9 3 (表中の化合物番号 1 2 6 0 の化合物)

5 - (5 - クロロ - 7 - イソプロピル - 4 - メチルベンゾオキサゾール - 2 -
イルチオ) - N - [2 , 4 - ビス (メチルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル]
ペンタンアミドの製造 :

2 - メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに 5 - クロロ - 7 - イソプロピル
- 2 - メルカプト - 4 - メチルベンゾオキサゾールを用いて実施例 4 6 と同様に
反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 155 - 156 °C.

¹H - NMR (d₆-DMSO) δ :

1.31 (6H, d, J = 7.1 Hz), 1.72 - 1.85 (2H, m), 1.85 - 1.98 (2H, m),
2.36 (3H, s), 2.39 (3H, s), 2.32 - 2.40 (2H, m),
2.43 (3H, s), 2.46 (3H, s), 3.22 (1H, sept, J = 7.1 Hz),

3.31 - 3.42 (2H, m), 6.84 (1H, s), 7.13 (1H, s), 8.73 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 525 ($M^+; ^{37}\text{Cl}$), 523 ($M^+; ^{35}\text{Cl}$), 200 (100).

実施例 9 4 (表中の化合物番号 1 2 6 2 の化合物)

7 - (5 - クロロ - 7 - イソプロピル - 4 - メチルベンゾオキサゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ビス (メチルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] ヘプタンアミドの製造:

2 - メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに 5 - クロロ - 7 - イソプロピル - 2 - メルカプト - 4 - メチルベンゾオキサゾールを用いて実施例 4 7 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色プリズム晶として得た。

融点 : 129 - 131 °C

IR (KBr) cm^{-1} : 3413, 3241, 2964, 2924,
1655, 1567, 1505, 1490,
1435, 1149.

^1H -NMR (d_6 -DMSO) δ :

1.31 (6H, d, $J = 7.1$ Hz), 1.40 - 1.55 (4H, m), 1.56 - 1.70 (2H, m),
1.83 (2H, quint, $J = 7.1$ Hz), 2.30 (2H, t, $J = 7.1$ Hz),
2.38 (3H, s), 2.40 (3H, s), 2.41 (3H, s), 2.46 (3H, s),
3.21 (1H, sept, $J = 7.1$ Hz), 3.34 (2H, t, $J = 7.1$ Hz),
6.84 (1H, s), 7.14 (1H, s), 8.51 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 553 ($M^+; ^{37}\text{Cl}$), 551 ($M^+; ^{35}\text{Cl}$),
200 (100).

実施例 9 5 (表中の化合物番号 1 2 6 3 の化合物)

8 - (5 - クロロ - 7 - イソプロピル - 4 - メチルベンゾオキサゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ビス (メチルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] オクタンアミドの製造:

2 - メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに 5 - クロロ - 7 - イソプロピル - 2 - メルカプト - 4 - メチルベンゾオキサゾールを用いて実施例 4 8 と同様に

反応・処理し、目的化合物を無色結晶として得た。

融点 : 128 - 131 °C

I R (K B r) cm^{-1} : 3423, 3231, 2929, 1662,
1504, 1489.

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.32 (6H, d, $J = 7.0$ Hz), 1.38 - 1.43 (4H, m),
1.49 (2H, quint, $J = 7.2$ Hz), 1.60 - 1.69 (2H, m),
1.84 (2H, quint, $J = 7.2$ Hz), 2.23 - 2.33 (2H, m), 2.40 (3H, s),
2.42 (3H, s), 2.45 (3H, s), 2.47 (3H, s),
3.23 (1H, sept, $J = 7.0$ Hz), 3.35 (1H, t, $J = 7.2$ Hz),
6.86 (1H, s), 7.15 (1H, s), 8.78 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 567 (M^+ ; ^{37}Cl), 565 (M^+ ; ^{35}Cl),
200 (100).

実施例 96 (表中の化合物番号 1267 の化合物)

2 - (7 - トリフルオロメチルベンゾオキサゾール - 2 - イルチオ) - N -
[2, 4 - ビス (エチルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] アセトアミドの製
造:

3 - アミノ - 2, 4 - ビス (メチルチオ) - 6 - メチルピリジンの代わりに 3 -
アミノ - 2, 4 - ビス (エチルチオ) - 6 - メチルピリジンを用いて実施例 8
9 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色プリズム晶として得た。

融点 : 182 - 183 °C

I R (K B r) cm^{-1} : 3435, 3244, 1663, 1508,
1432, 1332.

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

1.16 (3H, t, $J = 7.4$ Hz), 1.20 (3H, t, $J = 7.4$ Hz), 2.42 (3H, s),
2.81 (2H, q, $J = 7.4$ Hz), 3.03 (2H, q, $J = 7.4$ Hz), 4.14 (2H, s),
6.63 (1H, s), 7.40 (1H, t, $J = 7.8$ Hz), 7.52 (1H, d, $J = 7.8$ Hz),
7.68 (1H, d, $J = 7.8$ Hz), 8.34 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 487 (M^+), 235 (100).

元素分析 : $C_{20}H_{20}F_3N_3O_2S_3$ として

計算値 : C, 49.27; H, 4.13; N, 8.62; F, 11.69.

実測値 : C, 49.41; H, 4.20; N, 8.62; F, 11.59.

実施例 97 (表中の化合物番号 1269 の化合物)

4-(7-トリフルオロメチルベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ブタンアミドの製造:

2-メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカプト-7-トリフルオロメチルベンゾオキサゾールを用いて実施例57と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

融点 : 148-150℃

IR (KBr) cm^{-1} : 3439, 3256, 2975, 2929,
1656, 1509, 1433, 1332,
1125.

1H -NMR (d_6 -DMSO) δ :

1.23 (3H, t, $J = 7.3$ Hz), 1.24 (3H, t, $J = 7.3$ Hz),
2.04 - 2.22 (2H, m), 2.42 (3H, s),
2.47 - 2.48 (2H, m), 2.92 (2H, q, $J = 7.3$ Hz),
3.04 (2H, q, $J = 7.3$ Hz), 3.42 - 3.51 (2H, m), 6.87 (1H, s),
7.51 (1H, t, $J = 7.8$ Hz) 7.59 (1H, d, $J = 7.8$ Hz),
7.89 (1H, d, $J = 7.8$ Hz), 8.95 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 515 (M^+), 227 (100).

実施例 98 (表中化合物番号 1270 の化合物)

5-(7-トリフルオロメチルベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ペンタンアミドの製造:

2-メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカプト-7-トリフルオロメチルベンゾオキサゾールを用いて実施例58と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

融点 : 155 - 156 °C

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.20 - 1.30 (6H, m), 1.73 - 2.05 (4H, m), 2.30 - 2.41 (2H, m),
2.42 (3H, s), 2.85 - 3.00 (2H, m), 3.01 - 3.09 (2H, m),
3.37 - 3.48 (2H, m), 6.88 (1H, s), 7.51 (1H, t, J = 7.5 Hz),
7.60 (1H, d, J = 7.5 Hz), 7.90 (1H, d, J = 7.5 Hz),
8.75 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 529 (M⁺), 227 (100).

実施例99 (表中の化合物番号1272の化合物)

7-(7-トリフルオロメチルベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ヘプタンアミドの製造:

2-メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカプト-7-トリフルオロメチルベンゾオキサゾールを用いて実施例59と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 127 - 128 °C

IR (KBr) cm⁻¹: 3448, 1659, 1506, 1336,
1128, 1116.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.24 (3H, t, J = 7.3 Hz), 1.25 (3H, t, J = 7.3 Hz),
1.39 - 1.56 (4H, m), 1.56 - 1.72 (2H, m), 1.78 - 1.91 (2H, m),
2.19 - 2.33 (2H, m), 2.42 (3H, s), 2.92 (2H, q, J = 7.3 Hz),
3.05 (2H, q, J = 7.3 Hz), 3.37 (2H, t, J = 7.2 Hz), 6.86 (1H, s),
7.49 (1H, t, J = 7.9 Hz), 7.58 (1H, d, J = 7.9 Hz),
7.88 (1H, d, J = 7.9 Hz), 8.67 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 557 (M^+), 227 (100).

実施例 100 (表中の化合物番号 1273 の化合物)

8-(7-トリフルオロメチルベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]オクタンアミドの製造:

2-メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカプト-7-トリフルオロメチルベンゾオキサゾールを用いて実施例60と同様に反応・処理し、目的化合物を無色結晶として得た。

融点 : 99-100℃

IR (KBr) cm^{-1} : 3425, 3245, 2923, 1655,
1509, 1433, 1332, 1125.

1H -NMR (d_6 -DMSO) δ :

1.26 (3H, t, $J = 7.3$ Hz), 1.27 (3H, t, $J = 7.3$ Hz),
1.38 - 1.43 (4H, m), 1.49 (2H, quint, $J = 7.2$ Hz),
1.60 - 1.68 (2H, m), 1.85 (2H, quint, $J = 7.2$ Hz),
2.20 - 2.30 (2H, m), 2.43 (3H, s), 2.94 (2H, q, $J = 7.3$ Hz),
3.06 (2H, q, $J = 7.3$ Hz), 3.38 (2H, t, $J = 7.2$ Hz),
6.88 (1H, s), 7.51 (1H, t, $J = 7.8$ Hz), 7.60 (1H, d, $J = 7.8$ Hz),
7.90 (1H, d, $J = 7.8$ Hz), 8.73 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 571 (M^+), 227 (100).

実施例 101 (表中化合物番号 1274 の化合物)

9-(7-トリフルオロメチルベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ノナンアミドの製造:

2-メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカプト-7-トリフルオロメチルベンゾオキサゾールを用いて実施例28と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

融点 : 115 - 116 °C

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.26 (3H, t, J = 7.2 Hz), 1.27 (3H, t, J = 7.2 Hz),
 1.31 - 1.55 (8H, m), 1.57 - 1.69 (2H, m),
 1.84 (2H, quint, J = 6.9 Hz), 2.18 - 2.34 (2H, m),
 2.43 (3H, s), 2.94 (2H, q, J = 7.2 Hz), 3.06 (2H, q, J = 7.2 Hz),
 3.37 (2H, t, J = 7.3 Hz), 6.88 (1H, s), 7.51 (1H, t, J = 8.4 Hz),
 7.61 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.90 (1H, d, J = 8.4 Hz),
 8.73 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 585 (M⁺), 227 (100).

実施例 102 (表中の化合物番号 1279 の化合物)

4-(5-クロロ-7-イソプロピル-4-メチルベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ブタンアミドの製造:

2-メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに5-クロロ-7-イソプロピル-2-メルカプト-4-メチルベンゾオキサゾールを用いて実施例57と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 122 - 123 °C.

IR (KBr) cm⁻¹: 3258, 1665, 1502, 1145.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.23 (3H, t, J = 7.3 Hz), 1.24 (3H, t, J = 7.3 Hz),
 1.31 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.15 (2H, t, J = 7.0 Hz), 2.42 (3H, s),
 2.46 (3H, s), 2.47 - 2.50 (2H, m), 2.92 (2H, q, J = 7.3 Hz),
 3.04 (2H, q, J = 7.3 Hz), 3.22 (1H, sept, J = 6.8 Hz),
 3.43 (2H, t, J = 7.0 Hz), 6.87 (1H, s), 7.14 (1H, s),
 8.83 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 559 (M⁺:³⁷Cl), 557 (M⁺:³⁵Cl),
 227 (100).

実施例 103 (表中化合物番号 1280 の化合物)

5 - (5 - クロロ - 7 - イソプロピル - 4 - メチルベンゾオキサゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ビス (エチルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] ペンタンアミドの製造:

2 - メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに 5 - クロロ - 7 - イソプロピル - 2 - メルカプト - 4 - メチルベンゾオキサゾールを用いて実施例 58 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

融点 : 141 - 142 °C

¹H - NMR (d₆-DMSO) δ :

1.25 (3H, t, J = 7.4 Hz), 1.26 (3H, t, J = 7.4 Hz),

1.32 (6H, d, J = 6.9 Hz), 1.75 - 1.86 (2H, m),

1.87 - 2.00 (2H, m), 2.30 - 2.40 (2H, m), 2.43 (3H, s),

2.45 - 2.52 (3H, s), 2.92 (2H, q, J = 7.4 Hz),

3.04 (2H, q, J = 7.4 Hz), 3.23 (1H, sept, J = 6.9 Hz),

3.33 - 3.43 (2H, m), 6.88 (1H, s), 7.15 (1H, s), 8.82 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 553 (M⁺; ³⁷Cl), 551 (M⁺; ³⁵Cl),
227 (100).

実施例 104 (表中の化合物番号 1282 の化合物)

7 - (5 - クロロ - 7 - イソプロピル - 4 - メチルベンゾオキサゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ビス (エチルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] ヘプタンアミドの製造:

2 - メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに 5 - クロロ - 7 - イソプロピル - 2 - メルカプト - 4 - メチルベンゾオキサゾールを用いて実施例 59 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色プリズム晶として得た。

融点 : 117 - 120 °C.

IR (KBr) cm⁻¹: 3320, 1668, 1506, 1482,
1150.

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.24 (3H, t, $J = 7.3$ Hz), 1.25 (3H, t, $J = 7.3$ Hz),
 1.31 (6H, d, $J = 6.8$ Hz), 1.39 - 1.57 (4H, m), 1.57 - 1.71 (2H, m),
 1.77 - 1.89 (2H, m), 2.19 - 2.30 (2H, m), 2.42 (3H, s),
 2.46 (3H, s), 2.92 (2H, q, $J = 7.3$ Hz), 3.05 (2H, q, $J = 7.3$ Hz),
 3.21 (1H, sept, $J = 6.8$ Hz), 3.33 (2H, t, $J = 7.2$ Hz),
 6.86 (1H, s), 7.13 (1H, s), 8.66 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 581 ($M^+; ^{37}\text{Cl}$), 579 ($M^+; ^{35}\text{Cl}$),
 227 (100).

実施例 105 (表中の化合物番号 1283 の化合物)

8 - (5 - クロロ - 7 - イソプロピル - 4 - メチルベンゾオキサゾール - 2 -
 イルチオ) - N - [2, 4 - ビス (エチルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル]
 オクタンアミドの製造:

2 - メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに 5 - クロロ - 7 - イソプロピル
 - 2 - メルカプト - 4 - メチルベンゾオキサゾールを用いて実施例 60 と同様に
 反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 82 - 84 °C

IR (KBr) cm^{-1} : 3435, 3259, 2929, 1655,
 1504, 1490.

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.26 (3H, t, $J = 7.3$ Hz), 1.27 (3H, t, $J = 7.3$ Hz),
 1.32 (6H, d, $J = 6.8$ Hz), 1.39 - 1.43 (4H, m),
 1.49 (2H, quint, $J = 7.2$ Hz), 1.60 - 1.68 (2H, m),
 1.84 (2H, quint, $J = 7.2$ Hz), 2.22 - 2.32 (2H, m), 2.43 (3H, s),
 2.47 (3H, s), 2.94 (2H, q, $J = 7.3$ Hz), 3.06 (2H, q, $J = 7.3$ Hz),
 3.22 (1H, sept, $J = 6.8$ Hz), 3.35 (2H, t, $J = 7.2$ Hz),
 6.88 (1H, s), 7.15 (1H, s), 8.73 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 595 ($M^+; ^{37}\text{Cl}$), 593 ($M^+; ^{35}\text{Cl}$).

227 (100).

実施例 106 (表中化合物番号 1284 の化合物)

9 - (5 - クロロ - 7 - イソプロピル - 4 - メチルベンゾオキサゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ビス (エチルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] ノナンアミドの製造:

2 - メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに 5 - クロロ - 7 - イソプロピル - 2 - メルカプト - 4 - メチルベンゾオキサゾールを用いて実施例 28 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

融点 : 93 - 94 °C

¹H - NMR (d₆-DMSO) δ :

1.27 (3H, t, J = 7.3 Hz), 1.28 (3H, t, J = 7.3 Hz),
 1.32 (6H, d, J = 7.0 Hz), 1.29 - 1.55 (8H, m),
 1.56 - 1.69 (2H, m), 1.83 (2H, quint, J = 6.9 Hz),
 2.07 - 2.17 (2H, m), 2.43 (3H, s),
 2.45 - 2.49 (3H, m), 2.94 (2H, q, J = 7.3 Hz),
 3.07 (2H, q, J = 7.3 Hz), 3.22 (1H, sept, J = 7.0 Hz),
 3.34 (2H, t, J = 7.3 Hz), 6.88 (1H, s), 7.15 (1H, s),
 8.73 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 609 (M⁺; ³⁷Cl), 607 (M⁺; ³⁵Cl),
 229 (100).

実施例 107 (表中の化合物番号 1287 の化合物)

2 - (7 - トリフルオロメチルベンゾオキサゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ビス (イソプロピルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] アセトアミドの製造:

2 - ブロモ - N - [2, 4 - ビス (メチルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジ
 ル] アセトアミドの代わりに 2 - ブロモ - N - [2, 4 - ビス (イソプロピルチ
 オ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] アセトアミドを用いて実施例 89 と同様に反

に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 121 - 122 °C

IR (KBr) cm^{-1} : 3426, 3210, 2967, 1655,
1507, 1431, 1329.

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

1.17 (6H, d, $J = 6.8 \text{ Hz}$), 1.19 (6H, d, $J = 6.8 \text{ Hz}$), 2.42 (3H, s),
3.39 (1H, sept, $J = 6.8 \text{ Hz}$), 3.90 (1H, sept, $J = 6.8 \text{ Hz}$),
4.13 (2H, s), 6.68 (1H, s), 7.41 (1H, t, $J = 7.9 \text{ Hz}$),
7.52 (1H, d, $J = 7.9 \text{ Hz}$), 7.80 (1H, d, $J = 7.9 \text{ Hz}$),
8.30 (1H, br s).

EMS m/z (relative intensity): 515 (M^+), 181 (100).

元素分析: $\text{C}_{22}\text{H}_{24}\text{F}_3\text{N}_3\text{O}_2\text{S}_3$ として

計算値: C, 51.25; H, 4.69; N, 8.15; F, 11.05.

実測値: C, 51.28; H, 4.73; N, 8.07; F, 11.02.

実施例 108 (表中の化合物番号 1289 の化合物)

4-(7-トリフルオロメチルベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(イソプロピルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ブタンアミドの製造:

2-メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカプト-7-トリフルオロメチルベンゾオキサゾールを用いて実施例 69 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色プリズム晶として得た。

融点 : 135 - 136 °C

IR (KBr) cm^{-1} : 3446, 3255, 2968, 1660,
1559, 1531, 1504, 1491,
1433, 1139.

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.27 (6H, d, $J = 6.8 \text{ Hz}$), 1.29 (6H, d, $J = 6.8 \text{ Hz}$),
2.13 - 2.21 (2H, m), 2.42 (3H, s).

2.47 - 2.50 (2H, m), 3.44 - 3.50 (2H, m),
 3.55 (1H, sept, J = 6.8 Hz), 3.88 (1H, sept, J = 6.8 Hz),
 6.92 (1H, s), 7.51 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.59 (1H, d, J = 7.8 Hz),
 7.88 (1H, d, J = 7.8 Hz), 8.91 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 543 (M⁺), 207 (100).

実施例 109 (表中の化合物番号 1290 の化合物)

5 - (7 - トリフルオロメチルベンゾオキサゾール - 2 - イルチオ) - N -
 [2, 4 - ビス (イソプロピルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] ペンタンア
 ミドの製造:

2 - メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに 2 - メルカプト - 7 - トリフル
 オロメチルベンゾオキサゾールを用いて実施例 70 と同様に反応・処理し、目的
 化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 118 - 120 °C

I R (K B r) c m⁻¹: 3208, 3163, 1663, 1506,
 1431, 1328, 1139.

¹H - N M R (d₆ - D M S O) δ:

1.27 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.30 (6H, d, J = 6.8 Hz),
 1.73 - 1.87 (2H, m), 1.87 - 2.01 (2H, m), 2.23 - 2.38 (2H, m),
 2.41 (3H, s), 3.41 (2H, t, J = 7.0 Hz), 3.54 (1H, sept, J = 6.8 Hz),
 3.88 (1H, sept, J = 6.8 Hz), 6.91 (1H, s), 7.49 (1H, t, J = 7.9 Hz),
 7.58 (1H, d, J = 7.9 Hz), 7.88 (1H, d, J = 7.9 Hz),
 8.67 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 557 (M⁺), 221 (100).

実施例 110 (表中の化合物番号 1291 の化合物)

6 - (7 - トリフルオロメチルベンゾオキサゾール - 2 - イルチオ) - N -
 [2, 4 - ビス (イソプロピルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] ヘキサンア
 ミドの製造:

2-メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカプト-7-トリフルオロメチルベンゾオキサゾールを用いて実施例36と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 102 - 103 °C

IR (KBr) cm^{-1} : 3136, 1648, 1507, 1431,
1332, 1129.

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.28 (6H, d, $J = 6.8$ Hz), 1.31 (6H, d, $J = 6.8$ Hz),
1.49 - 1.76 (4H, m), 1.77 - 1.94 (2H, m),
2.19 - 2.32 (2H, m), 2.42 (3H, s), 3.38 (2H, t, $J = 7.3$ Hz),
3.55 (1H, sept, $J = 6.8$ Hz), 3.89 (1H, sept, $J = 6.8$ Hz),
6.91 (1H, s), 7.49 (1H, t, $J = 7.8$ Hz), 7.58 (1H, d, $J = 7.8$ Hz),
7.87 (1H, d, $J = 7.8$ Hz), 8.62 (1H, br s).

EMS m/z (relative intensity): 571 (M^+), 235 (100).

実施例111 (表中の化合物番号1292の化合物)

7-(7-トリフルオロメチルベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(イソプロピルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ヘプタンアミドの製造:

2-メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカプト-7-トリフルオロメチルベンゾチアゾールを用いて実施例71と同様に反応・処理し、目的化合物を無色結晶として得た。

融点 : 76 - 78 °C

IR (KBr) cm^{-1} : 3423, 3268, 2931, 1660,
1506, 1433, 1334.

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.29 (6H, d, $J = 6.8$ Hz), 1.31 (6H, d, $J = 6.8$ Hz),
1.43 - 1.54 (4H, m), 1.61 - 1.69 (2H, m),
1.86 (2H, quint, $J = 7.2$ Hz), 2.18 - 2.32 (2H, m), 2.43 (3H, s).

3.39 (2H, t, $J = 7.2$ Hz), 3.56 (1H, sept, $J = 6.8$ Hz),
 3.90 (1H, sept, $J = 6.8$ Hz), 6.93 (1H, s),
 7.51 (1H, dd, $J = 8.1, 7.8$ Hz), 7.60 (1H, d, $J = 7.8$ Hz),
 7.90 (1H, d, $J = 8.1$ Hz), 8.68 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 585 (M^+), 249 (100).

実施例 112 (表中の化合物番号 1293 の化合物)

8-(7-トリフルオロメチルベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(イソプロピルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]オクタンアミドの製造:

2-メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカプト-7-トリフルオロメチルベンゾオキサゾールを用いて実施例 72 と同様に反応・処理し、目的化合物を淡黄色油状物質として得た。

IR (Cap) cm^{-1} : 3246, 2964, 2930, 1664,
 1559, 1506, 1432.

1H -NMR (d_6 -DMSO) δ :

1.28 (6H, d, $J = 6.8$ Hz), 1.30 (6H, d, $J = 6.8$ Hz),
 1.32 - 1.50 (6H, m), 1.56 - 1.66 (2H, m),
 1.83 (2H, quint, $J = 7.1$ Hz), 2.17 - 2.27 (2H, m),
 2.42 (3H, s), 3.36 (2H, t, $J = 7.1$ Hz),
 3.55 (1H, sept, $J = 6.8$ Hz), 3.89 (1H, sept, $J = 6.8$ Hz),
 6.91 (1H, s), 7.50 (1H, t, $J = 7.8$ Hz), 7.59 (1H, d, $J = 7.8$ Hz),
 7.88 (1H, d, $J = 7.8$ Hz), 8.65 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 599 (M^+), 263 (100).

実施例 113 (表中の化合物番号 1294 の化合物)

9-(7-トリフルオロメチルベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(イソプロピルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ノナンアミドの製造:

2-メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカプト-7-トリフルオロメチルベンゾオキサゾールを用いて実施例73と同様に反応・処理し、目的化合物を淡黄色粉末晶として得た。

融点 : 97-98℃

IR (KBr) cm^{-1} : 3446, 3266, 2928, 1661,
1560, 1506, 1335, 1127.

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.28 (6H, d, $J = 6.6$ Hz), 1.30 (6H, d, $J = 6.8$ Hz),
1.28 - 1.51 (8H, m), 1.55 - 1.64 (2H, m),
1.83 (2H, quint, $J = 7.3$ Hz), 2.20 - 2.30 (2H, m),
2.42 (3H, s), 3.36 (2H, t, $J = 7.3$ Hz),
3.55 (1H, sept, $J = 6.6$ Hz), 3.89 (1H, sept, $J = 6.8$ Hz),
6.91 (1H, s), 7.50 (1H, t, $J = 7.8$ Hz), 7.59 (1H, d, $J = 7.8$ Hz),
7.89 (1H, d, $J = 7.8$ Hz), 8.71 (1H, br s).

EMS m/z (relative intensity): 613 (M^+), 277 (100).

実施例114 (表中の化合物番号1299の化合物)

4-(5-クロロ-7-イソプロピル-4-メチルベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(イソプロピルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ブタンアミドの製造:

2-メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに5-クロロ-2-メルカプト-4-メチルベンゾオキサゾールを用いて実施例69と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 141-143℃.

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.27 (6H, d, $J = 6.8$ Hz), 1.29 (6H, d, $J = 6.8$ Hz),
1.31 (6H, d, $J = 6.8$ Hz), 2.03 - 2.21 (2H, m), 2.42 (3H, s),
2.43 - 2.50 (5H, m), 3.22 (1H, sept, $J = 6.8$ Hz),
3.38 - 3.48 (2H, m), 3.55 (1H, sept, $J = 6.8$ Hz),

3.88 (1H, sept, $J = 6.8$ Hz), 6.92 (1H, s), 7.14 (1H, s),
8.87 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 567 ($M^+ : ^{37}\text{Cl}$), 565 ($M^+ : ^{35}\text{Cl}$),
207 (100).

実施例 115 (表中の化合物番号 1300 の化合物)

5 - (5 - クロロ - 7 - イソプロピル - 4 - メチルベンゾオキサゾール - 2 -
イルチオ) - N - [2, 4 - ビス (イソプロピルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリ
ジル] ペンタンアミドの製造:

2 - メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに 5 - クロロ - 7 - イソプロピル
- 2 - メルカプト - 4 - メチルベンゾオキサゾールを用いて実施例 70 と同様に
反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 143 - 145 °C.

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.27 (6H, d, $J = 6.8$ Hz), 1.29 (6H, d, $J = 6.8$ Hz),
1.31 (6H, d, $J = 6.8$ Hz), 1.73 - 1.85 (2H, m), 1.85 - 1.98 (2H, m),
2.25 - 2.37 (2H, m), 2.41 (3H, s),
2.43 - 2.50 (3H, s), 3.21 (1H, sept, $J = 6.8$ Hz),
3.37 (2H, t, $J = 7.2$ Hz), 3.54 (1H, sept, $J = 6.8$ Hz),
3.88 (1H, sept, $J = 6.8$ Hz), 6.92 (1H, s), 7.14 (1H, s),
8.76 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 581 ($M^+ : ^{37}\text{Cl}$),
579 ($M^+ : ^{35}\text{Cl}$, 100).

実施例 116 (表中の化合物番号 1301 の化合物)

6 - (5 - クロロ - 7 - イソプロピル - 4 - メチルベンゾオキサゾール - 2 -
イルチオ) - N - [2, 4 - ビス (イソプロピルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリ
ジル] ヘキサンアミドの製造:

2 - メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに 5 - クロロ - 7 - イソプロピル

－２－メルカプト－４－メチルベンゾオキサゾールを用いて実施例３６と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 99－101℃

I R (K B r) cm^{-1} : 3413, 3224, 2964, 1663,
1506, 1148.

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.29 (6H, d, $J = 6.8$ Hz), 1.32 (12H, d, $J = 6.8$ Hz),
1.54 - 1.62 (2H, m), 1.70 (2H, quint, $J = 7.1$ Hz),
1.87 (2H, quint, $J = 7.1$ Hz), 2.22 - 2.33 (2H, m), 2.43 (3H, s),
2.48 (3H, s), 3.23 (1H, sept, $J = 6.8$ Hz), 3.36 (2H, t, $J = 7.1$ Hz),
3.57 (1H, sept, $J = 6.8$ Hz), 3.90 (1H, sept, $J = 6.8$ Hz),
6.93 (1H, s), 7.15 (1H, s), 8.72 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 595 (M^+ ; ^{37}Cl), 593 (M^+ ; ^{35}Cl),
518 (100).

実施例 117 (表中の化合物番号 1302 の化合物)

7－（５－クロロ－７－イソプロピル－４－メチルベンゾオキサゾール－２－イルチオ）－N－〔２，４－ビス（イソプロピルチオ）－６－メチル－３－ピリジル〕ヘプタンアミドの製造：

２－メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに５－クロロ－７－イソプロピル－４－メチル－２－メルカプトベンゾオキサゾールを用いて実施例 71 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 91－93℃

I R (K B r) cm^{-1} : 3436, 3213, 3169, 2962,
2929, 1666, 1505, 1152.

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.29 (6H, d, $J = 6.8$ Hz), 1.31 (6H, d, $J = 6.8$ Hz),
1.31 (6H, d, $J = 6.8$ Hz), 1.40 - 1.52 (4H, m), 1.60 - 1.68 (2H, m),
1.85 (2H, quint, $J = 7.1$ Hz), 2.17 - 2.32 (2H, m), 2.43 (3H, s),

2.47 (3H, s), 3.22 (1H, sept, $J = 6.8$ Hz), 3.35 (2H, t, $J = 7.1$ Hz),
 3.56 (1H, sept, $J = 6.8$ Hz), 3.90 (1H, sept, $J = 6.8$ Hz),
 6.93 (1H, s), 7.15 (1H, s), 8.67 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 609 (M^+ ; ^{37}Cl), 607 (M^+ ; ^{35}Cl),
 532 (100).

実施例 118 (表中の化合物番号 1303 の化合物)

8 - (5 - クロロ - 7 - イソプロピル - 4 - メチルベンゾオキサゾール - 2 -
 イルチオ) - N - [2, 4 - ビス (イソプロピルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリ
 ジル] オクタンアミドの製造:

2 - メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに 5 - クロロ - 7 - イソプロピル
 - 2 - メルカプト - 4 - メチルベンゾオキサゾールを用いて実施例 72 と同様に
 反応・処理し、目的化合物を淡黄色油状物質として得た。

IR (Cap) cm^{-1} : 3242, 2964, 2928, 1668,
 1559, 1506, 1148.

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.28 (6H, d, $J = 6.6$ Hz), 1.31 (12H, d, $J = 6.8$ Hz),
 1.32 - 1.50 (6H, m), 1.57 - 1.67 (2H, m),
 1.82 (2H, quint, $J = 7.1$ Hz), 2.17 - 2.27 (2H, m),
 2.42 (3H, s), 2.46 (3H, s), 3.21 (1H, sept, $J = 6.8$ Hz),
 3.33 (2H, t, $J = 7.1$ Hz), 3.55 (1H, sept, $J = 6.6$ Hz),
 3.89 (1H, sept, $J = 6.8$ Hz), 6.91 (1H, s),
 7.14 (1H, s), 8.65 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 623 (M^+ ; ^{37}Cl), 621 (M^+ ; ^{35}Cl),
 546 (100).

実施例 119 (表中の化合物番号 1304 の化合物)

9 - (5 - クロロ - 7 - イソプロピル - 4 - メチルベンゾオキサゾール - 2 -
 イルチオ) - N - [2, 4 - ビス (イソプロピルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリ

シル] ノナンアミドの製造:

2-メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに5-クロロ-7-イソプロピル-2-メルカプト-4-メチルベンゾオキサゾールを用いて実施例73と同様に反応・処理し、目的化合物を淡黄色油状物質として得た。

IR (Cap) cm^{-1} : 3249, 2961, 2926, 1667,
1563, 1505.

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ :

1.28 (6H, d, $J = 6.8 \text{ Hz}$), 1.30 (12H, d, $J = 7.1 \text{ Hz}$),
1.28 - 1.50 (8H, m), 1.55 - 1.65 (2H, m),
1.81 (2H, quint, $J = 7.1 \text{ Hz}$), 2.17 - 2.27 (2H, m),
2.41 (3H, s), 2.46 (3H, s), 3.21 (1H, sept, $J = 7.1 \text{ Hz}$),
3.32 (2H, t, $J = 7.1 \text{ Hz}$), 3.54 (1H, sept, $J = 6.8 \text{ Hz}$),
3.89 (1H, sept, $J = 7.1 \text{ Hz}$), 6.91 (1H, s),
7.14 (1H, s), 8.65 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 637 ($\text{M}^+ : ^{37}\text{Cl}$), 635 ($\text{M}^+ : ^{35}\text{Cl}$),
560 (100).

実施例120 (表中の化合物番号1317の化合物)

2-(7-メタンスルホニルベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]アセトアミドの製造:

2-メルカプト-7-トリフルオロメチルベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカプト-7-メタンスルホニルベンゾオキサゾールを用いて実施例96と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 159 - 162 $^{\circ}\text{C}$

IR (KBr) cm^{-1} : 3449, 3271, 2966, 2928,
1678, 1508, 1315, 1118.

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

1.14 (3H, t, $J = 7.3 \text{ Hz}$), 1.20 (3H, t, $J = 7.3 \text{ Hz}$), 2.43 (3H, s),
2.82 (2H, q, $J = 7.3 \text{ Hz}$), 3.01 (2H, q, $J = 7.3 \text{ Hz}$), 3.27 (2H, s),

4.15 (2H, s), 6.63 (1H, s), 7.49 (1H, t, $J = 7.9$ Hz),
 7.83 (1H, dd, $J = 7.9$, 1.2 Hz), 7.90 (1H, dd, $J = 7.9$, 1.2 Hz),
 8.17 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 497 (M^+), 311 (100).

元素分析: $C_{20}H_{23}N_3O_4S_4$ として

計算値: C, 48.27; H, 4.66; N, 8.44; S, 25.77...

実測値: C, 48.36; H, 4.66; N, 8.31; S, 25.76.

実施例 1 2 1 (表中の化合物番号 1 3 2 7 の化合物)

2 - (7 - メタンスルホニルベンゾオキサゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ビス (イソプロピルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] アセトアミドの製造:

2 - メルカプトベンゾチアゾールの代わりに 2 - メルカプト - 7 - メタンスルホニルベンゾオキサゾールを用いて実施例 7 4 と同様に反応・処理し、目的化合物を淡黄色アモルファスとして得た。

IR (KBr) cm^{-1} : 3435, 3337, 2965, 2926,
 1695, 1506, 1424, 1319,
 1117.

1H -NMR (CDCl₃) δ :

1.16 (6H, d, $J = 6.8$ Hz), 1.21 (6H, d, $J = 6.8$ Hz), 2.42 (3H, s),
 3.26 (3H, s), 3.40 (1H, sept, $J = 6.8$ Hz),
 3.90 (1H, sept, $J = 6.8$ Hz), 4.15 (2H, s), 6.68 (1H, s),
 7.49 (1H, t, $J = 7.9$ Hz), 7.83 (1H, dd, $J = 7.9$, 1.0 Hz),
 7.90 (1H, dd, $J = 7.9$, 1.0 Hz), 8.11 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 525 (M^+), 339 (100).

実施例 1 2 2 (表中化合物番号 1 3 4 1 の化合物)

6 - (ベンゾオキサゾール - 2 - イルチオ) - N - (4 - メチル - 2 - メチルチオ - 5 - ピリジル) ヘキサンアミドの製造:

ナトリウムチオメトキシド (436 mg, 5.9 mmol) のメタノール溶液 (8 ml) に、氷冷下で 2-クロロ-4-メチル-5-ニトロピリジン (2.0 g, 10.4 mmol) のメタノール溶液 (8 ml) を滴下し、室温に昇温して 15 時間攪拌後、反応混合物に水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して得られた粗生成物を、酢酸エチル-ヘキサンより再結晶し、4-メチル-2-メチルチオ-5-ニトロピリジン 1.02 g (収率 98 %) を淡黄色針状晶として得た。

このニトロピリジン (497 mg, 2.7 mmol) を酢酸 (15 ml) と濃塩酸 (0.5 ml) の混合溶媒に懸濁し、氷冷下で亜鉛 (2.12 g, 32.4 mmol) を少量ずつ加えた。氷冷下で 5 分間攪拌し、室温で 30 分間攪拌後反応混合物を濾過し、濾液を炭酸水素ナトリウム水溶液で中和し、塩化メチレンで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して得られた粗生成物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒; ヘキサン: 酢酸エチル = 1:1) で精製して、5-アミノ-4-メチル-2-メチルチオピリジン 352 mg (収率 85 %) を淡黄色粉末晶として得た。

3-アミノ-2, 4-ビス (メチルチオ) -6-メチルピリジンの代わりに 5-アミノ-4-メチル-2-メチルチオピリジンを用いて実施例 18 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

融点 : 125 - 127 °C

IR (KBr) cm^{-1} : 3433, 3284, 2930, 1654, 1598.

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ :

1.61 (2H, quint, $J = 7.4$ Hz), 1.83 (2H, quint, $J = 7.4$ Hz),
1.92 (2H, quint, $J = 7.4$ Hz), 2.19 (3H, s),
2.43 (2H, t, $J = 7.4$ Hz), 2.54 (3H, s), 3.33 (2H, t, $J = 7.4$ Hz),
6.92 (1H, br s), 7.03 (1H, s), 7.24 (1H, td, $J = 7.7, 1.7$ Hz),
7.28 (1H, td, $J = 7.7, 1.7$ Hz), 7.43 (1H, dd, $J = 7.7, 1.7$ Hz),
7.57 (1H, dd, $J = 7.7, 1.7$ Hz), 8.57 (1H, s).

EMS m/z (relative intensity): 401 (M^+), 69 (100).

実施例 1 2 3 (表中化合物番号 1 3 7 1 の化合物)

6 - (ベンゾオキサゾール - 2 - イルチオ) - N - (5 - メチルチオ - 2 - ピリジル) ヘキサンアミドの製造:

濃硫酸 (50 ml) を氷冷し、攪拌しながら 30 % 過酸化水素水 (25 ml) を滴下した。引き続き 2 - アミノ - 5 - クロロピリジン (5.0 g, 38.9 mmol) の濃硫酸 (50 ml) 溶液を滴下し室温で 48 時間攪拌した。反応液を氷中に加え、析出物を濾取し、得られた残渣をエタノールより再結晶し、5 - クロロ - 2 - ニトロピリジン 4.38 g (収率 71 %) を無色粉末晶として得た。

ナトリウムチオメトキシド (1.02 g, 13.9 mmol) のメタノール溶液 (20 ml) に、氷冷下で 5 - クロロ - 2 - ニトロピリジン (2.0 g, 12.6 mmol) のメタノール溶液 (40 ml) を滴下し、室温に昇温して 13 時間攪拌後、反応混合物に水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を留去して得られた残渣を、酢酸エチル - ヘキサンより再結晶し、5 - メチルチオ - 2 - ニトロピリジン 972 mg (収率 45 %) を得た。

このニトロピリジン (300 mg, 1.8 mmol) を酢酸 (7 ml) と濃塩酸 (0.5 ml) の混合溶媒に懸濁し、氷冷下で亜鉛 (692 mg, 10.6 mmol) を少量ずつ加えた。氷冷下で 5 分間攪拌し、室温で 30 分間攪拌後反応混合物を濾過し、濾液を炭酸水素ナトリウム水溶液で中和し、塩化メチレンで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して得られた粗生成物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒; ヘキサン: 酢酸エチル = 1:1 → クロロホルム: メタノール = 20:1) で精製して、2 - アミノ - 5 - メチルチオピリジン 158 mg (収率 64 %) を淡黄色粉末晶として得た。

3 - アミノ - 2, 4 - ビス (メチルチオ) - 6 - メチルピリジンの代わりに 2 - アミノ - 5 - メチルチオピリジンを用いて実施例 18 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

融点 : 83 - 85 °C

IR (KBr) cm^{-1} : 3246, 2930, 1684, 1576, 1522.

¹H-NMR (CDCl₃) δ:

1.59 (2H, quint, J = 7.4 Hz), 1.81 (2H, quint, J = 7.4 Hz),
 1.90 (2H, quint, J = 7.4 Hz), 2.42 (2H, t, J = 7.4 Hz),
 2.48 (3H, s), 3.32 (2H, t, J = 7.4 Hz),
 7.23 (1H, td, J = 7.4, 1.4 Hz), 7.28 (1H, td, J = 7.4, 1.4 Hz),
 7.43 (1H, dd, J = 7.4, 1.4 Hz), 7.59 (1H, dd, J = 7.4, 1.4 Hz),
 7.64 (1H, dd, J = 8.6, 2.5 Hz), 7.82 (1H, br s),
 8.15 (1H, d, J = 8.6 Hz), 8.18 (1H, d, J = 2.5 Hz).

EIMS m/z (relative intensity): 387 (M⁺, 100).

実施例 124 (表中化合物番号 1401 の化合物)

6-(ベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2, 4, 6-トリス(メチルチオ)-5-ピリミジル]ヘキサナムイドの製造:

4, 6-ジヒドロキシー-2-メチルピリミジンの代わりに 4, 6-ジヒドロキシー-2-メチルチオピリミジンを用いて実施例 88 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

融点: 149-153℃

IR (KBr) cm⁻¹: 3448, 3247, 2926, 1667,
 1496.

¹H-NMR (CDCl₃) δ:

1.46 - 1.62 (2H, m), 1.63 - 1.76 (2H, m), 1.77 - 1.91 (2H, m),
 2.20 - 2.36 (2H, m), 2.46 (9H, s), 3.36 (2H, t, J = 7.1 Hz),
 7.22 - 7.35 (2H, m), 7.51 - 7.62 (2H, m), 9.02 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 480 (M⁺, 100).

実施例 125 (表中の化合物番号 1427 の化合物)

2-(7-メトキシカルボニルベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2, 4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]アセトアミドの製造:

2-メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカプト-7-メトキシカルボニルベンゾオキサゾールを用いて実施例26と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 168-169℃

IR (KBr) cm^{-1} : 3433, 3257, 1727, 1677,
1513, 1297, 1120.

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

1.16 (3H, t, $J = 7.4$ Hz), 1.19 (3H, t, $J = 7.4$ Hz), 2.42 (3H, s),
2.80 (2H, q, $J = 7.4$ Hz), 3.03 (2H, q, $J = 7.4$ Hz), 4.00 (3H, s),
4.12 (2H, s), 6.63 (1H, s), 7.38 (1H, dd, $J = 8.1, 7.8$ Hz),
7.80 (1H, dd, $J = 8.1, 1.2$ Hz), 7.92 (1H, dd, $J = 7.8, 1.2$ Hz),
8.48 (1H, br s).

EMS m/z (relative intensity): 477 (M^+), 323 (100).

元素分析: $\text{C}_{21}\text{H}_{23}\text{N}_3\text{O}_4\text{S}_3$ として

計算値: C, 52.81; H, 4.85; N, 8.80; S, 20.14.

実測値: C, 52.90; H, 4.91; N, 8.73; S, 20.12.

実施例126 (表中の化合物番号1428の化合物)

2-(オキサゾロ[4,5-b]ピリジン-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]アセトアミドの製造:

2-メルカプトベンゾチアゾールの代わりに2-メルカプトオキサゾロ[4,5-b]ピリジンを用いて実施例49と同様に反応・処理し、目的化合物を無色結晶として得た。

IR (KBr) cm^{-1} : 3460, 3167, 2972, 1685,
1561.

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

1.14 (3H, t, $J = 7.4$ Hz), 1.21 (3H, t, $J = 7.4$ Hz),
2.42 (3H, s), 2.82 (2H, q, $J = 7.4$ Hz),
3.02 (2H, q, $J = 7.4$ Hz), 4.16 (2H, s), 6.62 (1H, s),

7.25 (1H, dd, $J = 8.3, 5.1$ Hz), 7.78 (1H, dd, $J = 8.3, 1.2$ Hz),

8.40 (1H, br s), 8.49 (1H, dd, $J = 5.1, 1.2$ Hz).

EIMS m/z (relative intensity): 420 (M^+ , 100).

実施例 127 (表中の化合物番号 1257 の化合物)

2-(5-クロロ-7-イソプロピル-4-メチルベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]アセトアミドの製造:

2-メルカプトベンゾチアゾールの代わりに 5-クロロ-7-イソプロピル-2-メルカプト-4-メチルベンゾオキサゾールを用いて実施例 49 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

EIMS m/z (relative intensity): 481 (M^+), 210 (100).

実施例 128 (表中の化合物番号 1277 の化合物)

2-(5-クロロ-7-イソプロピル-4-メチルベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]アセトアミドの製造:

3-アミノ-2,4-ビス(メチルチオ)-6-メチルピリジンの代わりに 3-アミノ-2,4-ビス(エチルチオ)-6-メチルピリジンを用いて実施例 127 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

EIMS m/z (relative intensity): 511 ($M^+; ^{37}\text{Cl}$), 509 ($M^+; ^{35}\text{Cl}$),
235 (100).

実施例 129 (表中の化合物番号 1297 の化合物)

2-(5-クロロ-7-イソプロピル-4-メチルベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(イソプロピルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]アセトアミドの製造:

3-アミノ-2,4-ビス(メチルチオ)-6-メチルピリジンの代わりに 3-アミノ-2,4-ビス(イソプロピルチオ)-6-メチルピリジンを用いて実

施例 1 2 7 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

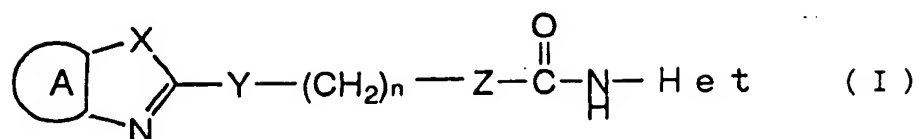
E I M S m/z (relative intensity): 539 ($M^+; ^{37}\text{Cl}$), 537 ($M^+; ^{35}\text{Cl}$),
223 (100).

産業上の利用性

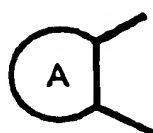
本発明は、新規アミド化合物及びこれを含有する医薬を提供し、より詳細には、前記一般式 (I) で表される化合物、これらの塩又はこれらの溶媒和物及びこれらの化合物からなる医薬組成物を提供する

請 求 の 範 囲

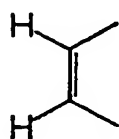
1. 一般式 (I)



(式中、



は、置換基を有していてもよいベンゼン、ビリジン、シクロヘキサン、又はナフタレンの2価残基、又は、基



を示し、

H e t は、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群から選ばれる少なくとも1個の異種原子を含有する5～8員の置換又は非置換の単環式、多環式又は縮合環式の複素環を示し、

X は、 ---NH--- 、酸素原子又は硫黄原子を示し、

Y は、 $\text{---NR}_4\text{---}$ 、酸素原子、硫黄原子、スルホキシド又はスルホンを示し、

Z は、単結合又は $\text{---NR}_5\text{---}$ を示し、

R₄ は、水素原子、低級アルキル基、アリール基又は置換基を有していてもよい

シリル低級アルキル基を示し、

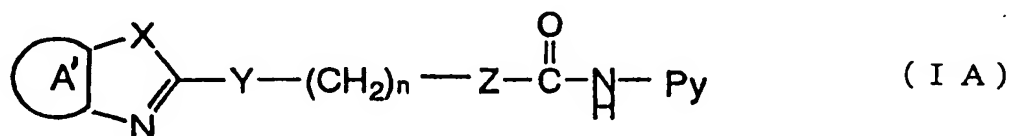
R_s は、水素原子、低級アルキル基、アリール基又は置換基を有していてもよいシリル低級アルキル基を示し、

n は、1乃至15の整数を示す。）

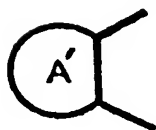
で表される化合物、これらの塩又はこれらの溶媒和物。

2. 前記一般式 (I) 中の Het が、置換又は非置換のピリジル基又はピリミジル基である請求の範囲第1項に記載の化合物、これらの塩又はこれらの溶媒和物。

3. 一般式 (IA)、



(式中、



は、置換基を有していてもよいベンゼン又はピリジンの2価残基を示し、

Py は、置換基を有していてもよいピリジル基又はピリミジル基を示し、

X は、 $-NH-$ 、酸素原子又は硫黄原子を示し、

Y は、 $-NR_4-$ 、酸素原子、硫黄原子、スルホキシド又はスルホンを示し、

Z は、単結合又は $-NR_s-$ を示し、

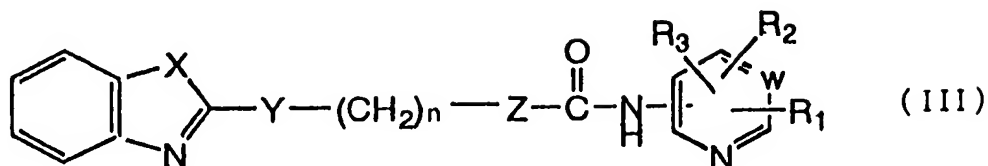
R_4 は、水素原子、低級アルキル基、アリール基又は置換基を有していてもよいシリル低級アルキル基を示し、

R_s は、水素原子、低級アルキル基、アリール基又は置換基を有していてもよいシリル低級アルキル基を示し、

n は、1 乃至 15 の整数を示す。）

で表される請求の範囲第 1 項又は 2 項に記載の化合物、これらの塩又はこれらの溶媒和物。

4. 一般式 (III)



(式中、W は、=CH-、又は、=N- を示し、

X は、-NH-、酸素原子又は硫黄原子を示し、

Y は、-NR₄-、酸素原子、硫黄原子、スルホキシド又はスルホンを示し、

Z は、単結合又は -NR₅- を示し、

R₁、R₂ 及び R₃ は、同一又は異なって、水素原子、低級アルキル基、低級アルコキシ基、ハロゲン原子、水酸基、リン酸基、スルホンアミド基、低級アルキルチオ基、置換基を有していてもよいアミノ基、又は、R₁、R₂、R₃ のいずれか 2 個が一緒になってアルキレンジオキシ基を示し、

R₄ は、水素原子、低級アルキル基、アリール基又は置換基を有していてもよいシリル低級アルキル基を示し、

R₅ は、水素原子、低級アルキル基、アリール基又は置換基を有していてもよいシリル低級アルキル基を示し、

n は、1 乃至 15 の整数を示す。）

で表される請求の範囲第 1 項、2 項又は 3 項に記載の化合物、これらの塩又はこれらの溶媒和物。

5. 請求の範囲第 1 項、2 項、3 項又は第 4 項の何れかに記載された化合物、その塩又は溶媒和物からなる少なくとも 1 種の化合物及び製薬上許容される担体とからなる医薬組成物。

6. A C A T 阻害剤、細胞内コレステロール輸送阻害剤、血中コレステロール低

下剤、又はマクロファージ泡沫化抑制剤である請求の範囲第 5 項に記載の医薬組成物。

7. 高脂血症、動脈硬化症、脳血管障害、虚血性心疾患、虚血性腸疾患、大動脈瘤の予防、治療剤である請求の範囲第 5 項又は第 6 項に記載の医薬組成物。

8. 請求の範囲第 1 項、2 項、3 項又は第 4 項の何れかに記載された化合物、その塩又は溶媒和物の少なくとも 1 種の化合物を含有してなる A C A T 阻害剤。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP98/05149

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
Int.Cl⁶ C07D403/12, C07D413/12, C07D417/12, A61K31/44, A61K31/505

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl⁶ C07D403/12, C07D413/12, C07D417/12, A61K31/44, A61K31/505

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)
REGISTRY (STN), CA (STN), CAOLD (STN), CAPLUS (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X A	JP, 4-139172, A (Sankyo Co., Ltd.), 13 May, 1992 (13. 05. 92) (Family: none)	1-5 6-8
X A	MAHMOUD, Abdalla M. et al., "Synthesis of some new aryl- and aralkylthiobenzoxazoles, -benzimidazoles and -benzothiazoles of potential biological interest", Gazz. Chim. Ital., Vol. 112, No. 1-2, p.55-56 (1982)	1-5 6-8
X A	MAHMOUD, Abdalla M. et al., "Synthesis and biological activities of some new 2-(N-heterocyclic carboxamidomethyl thio) benzoxazoles, benzthiazoles and benzimidazoles. Part VIII", Eur. J. Med. Chem.-Chim. Ther., Vol. 16, NO. 4, p.383-384 (1981)	1-5 6-8
X A	ABDEL Rahman, A.E. et al., "Synthesis and biological activities of some new 2-(N-heterocyclocarboxamidomethylthio)naphth[1,2-d]oxazoles. Part VI", J. Indian Chem. Soc., Vol. 58, No. 2, p.171-173 (1981)	1, 2, 5 3, 4, 6-8

☒ Further documents are listed in the continuation of Box C.

☐ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:	"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance	"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
"E" earlier document but published on or after the international filing date	"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)	"&" document member of the same patent family
"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means	
"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed	

Date of the actual completion of the international search
8 February, 1998 (08. 02. 98)

Date of mailing of the international search report
16 February, 1999 (16. 02. 99)

Name and mailing address of the ISA/
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP98/05149

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X A	EL-EZBAWY, S.R. et al., "Synthesis and antibacterial activity of some new pyridyl diaryl sulfide and diaryl sulfones", Phosphorus, Sulfur Silicon Relat. Elem., Vol. 48, No. 1-4, p.111-116 (1990)	1, 2, 5 3, 4, 6-8
X A	TURAN-ZITOUNI, G. et al., "Synthesis of some 5-methoxy-3-[(benzazole-2-yl)thioacetyl amino]-2,3-dihydrobenzofuran derivatives and investigation of their antihypertensive activities", Ann. Pharm. Fr., Vol. 54, No. 3, p.109-111 (1996)	1, 5 2-4, 6-8
X A	TRIVEDI, Bhavin et al., "Synthesis and antimicrobial activity of 2-aryl-3-(benzothiazol-2'-yl-thioacetamido)-5-H/methyl/carboxymethyl-4-thiazolidinones", Proc.- Indian Acad. Sci., Chem. Sci., Vol. 104, No. 4, p.489-496 (1992)	1, 5 2-4, 6-8
X A	JP, 62-42989, A (Sumitomo Pharmaceuticals Co., Ltd.), 24 February, 1987 (24. 02. 87) & JP, 56-30987, A & CA, 1152980, A & IT, 1146168, B	1, 5 2-4, 6-8
X A	JP, 51-16433, B (Fujisawa Pharmaceutical Co., Ltd.), 24 May, 1976 (24. 05. 76), Examples 1, 7 & JP, 54-34758, B	1, 5 2-4, 6-8
PA	JP, 10029986, A (Kowa Co., Ltd.), 3 February, 1998 (03. 02. 98) & EP, 807627, A2	1-8

国際調査報告

国際出願番号 PCT/JP98/05149

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl[°] C07D403/12, C07D413/12, C07D417/12, A61K31/44,
A61K31/505

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl[°] C07D403/12, C07D413/12, C07D417/12, A61K31/44,
A61K31/505

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

REGISTRY (STN), CA (STN), CAOLD (STN), CAPLUS (STN)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X A	JP, 4-139172, A (三共株式会社) 13. 5月. 1992 (13. 05. 92) (ファミリーなし)	1-5 6-8
X A	MAHMOUD, Abdalla M. et al., "Synthesis of some new aryl- and aralkylthiobenzoxazoles, -benzimidazoles and -benzothiazoles of potential biological interest", Gazz. Chim. Ital., Vol. 112, No. 1-2, p. 55-56 (1982)	1-5 6-8
X A	MAHMOUD, Abdalla M. et al., "Synthesis and biological activitie s of some new 2-(N-heterocyclic carboxamidomethyl thio) benzoxazoles, benzthiazoles and benzimidazoles. Part VIII", Eur. J. Med. Chem. - Chim. Ther., Vol. 16, NO. 4, p. 383-384 (1981)	1-5 6-8

☒ C欄の続きにも文献が列挙されている。☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

- 「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの
「E」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの
「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)
「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献
「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

- 「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの
「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの
「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの
「&」同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

08. 02. 98

国際調査報告の発送日

16.02.99

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/JP)
郵便番号 100-8915
東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

浅見 節子

4C

9638

電話番号 03-3581-1101 内線 3454

C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X A	ABDEL Rahman, A. E. et al., "Synthesis and biological activities of some new 2-(N-heterocyclocarboxamidomethylthio)naphth[1, 2-d]oxazoles. Part VI", J. Indian Chem. Soc., Vol. 58, No. 2, p. 171-173 (1981)	1, 2, 5 3, 4, 6-8
X A	EL-EZBAWY, S. R. et al., "Synthesis and antibacterial activity of some new pyridyl diaryl sulfide and diaryl sulfones", Phosphorus, Sulfur Silicon Relat. Elem., Vol. 48, No. 1-4, p. 111-116 (1990)	1, 2, 5 3, 4, 6-8
X A	TURAN-ZITOUNI, G. et al., "Synthesis of some 5-methoxy-3-[(benzazole-2-yl)thioacetyl amino]-2, 3-dihydrobenzofuran derivatives and investigation of their antihypertensive activities", Ann. Pharm. Fr., Vol. 54, No. 3, p. 109-111 (1996)	1, 5 2-4, 6-8
X A	TRIVEDI, Bhavin et al., "Synthesis and antimicrobial activity of 2-aryl-3-(benzothiazol-2'-yl-thioacetamido)-5-H/methyl/carboxymethyl-4-thiazolidinones", Proc. - Indian Acad. Sci., Chem. Sci., Vol. 104, No. 4, p. 489-496 (1992)	1, 5 2-4, 6-8
X A	JP, 62-42989, A (住友製薬株式会社) 24. 2月. 1987 (24. 02. 87) &JP, 56-30987, A &CA, 1152980, A &IT, 1146168, B	1, 5 2-4, 6-8
X A	JP, 51-16433, B (藤沢薬品工業株式会社) 24. 5月. 1976 (24. 05. 76) 実施例 1 及び 7 &JP, 54-34758, B	1, 5 2-4, 6-8
PA	JP, 10029986, A (興和株式会社) 3. 2月. 1998 (03. 02. 98) &EP, 807627, A2	1-8